

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2007-527909**(P2007-527909A)**

(43) 公表日 平成19年10月4日(2007.10.4)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 233/64 (2006.01)	C O 7 D 233/64 1 O 3	4 C O 6 3
C O 7 D 403/12 (2006.01)	C O 7 D 403/12 C S P	4 C O 8 4
A 6 1 K 31/4184 (2006.01)	A 6 1 K 31/4184	4 C O 8 6
C O 7 D 249/12 (2006.01)	C O 7 D 249/12 5 1 2	
A 6 1 K 31/4196 (2006.01)	A 6 1 K 31/4196	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 395 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号	特願2007-502940 (P2007-502940)	(71) 出願人	591011502
(86) (22) 出願日	平成17年3月7日 (2005.3.7)		ワイス
(85) 翻訳文提出日	平成18年11月7日 (2006.11.7)		W y e t h
(86) 国際出願番号	PCT/US2005/007667		アメリカ合衆国 O 7 9 4 O - O 8 7 4 ニュ
(87) 国際公開番号	W02005/086836		ージャージー州 マディソン、ファイブ・
(87) 国際公開日	平成17年9月22日 (2005.9.22)		ジラルダ・ファームズ
(31) 優先権主張番号	60/551, 510	(74) 代理人	100081422
(32) 優先日	平成16年3月8日 (2004.3.8)		弁理士 田中 光雄
(33) 優先権主張国	米国 (US)	(74) 代理人	100116311
(31) 優先権主張番号	60/551, 503		弁理士 元山 忠行
(32) 優先日	平成16年3月8日 (2004.3.8)	(74) 代理人	100122301
(33) 優先権主張国	米国 (US)		弁理士 富田 憲史
(31) 優先権主張番号	60/551, 472	(72) 発明者	ロバート・ゼル
(32) 優先日	平成16年3月8日 (2004.3.8)		アメリカ合衆国 O 1 7 7 5 マサチューセッ
(33) 優先権主張国	米国 (US)		ツ州ストウ、ブーン・ロード 6 7 番
			最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 イオンチャンネルモジュレーター

(57) 【要約】

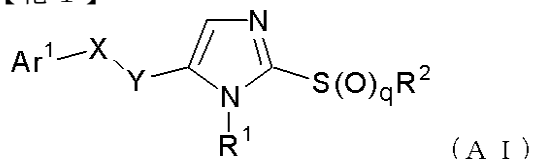
本発明は、化合物、化合物を含む組成物および化合物および組成物の使用方法に関する。本発明の化合物、組成物および方法は、イオンチャンネル機能の治療的モジュレーションおよび疾患および病徴、特にあるカルシウムチャンネルサブタイプターゲットにより介在される疾患の治療に用いることができる。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (A I) :

【化 1】



10

(式中、

Ar^1 はシクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであって、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

X は NR^3 、 $C(R^3)_2$ または O である；

Y は $C=O$ または低級アルキルである；

R^1 は、 Ar^2 または Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであって、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

q は 0、1 または 2 である；

各 R^2 は独立して、 $(CH_2)_m CO_2 R^3$ 、 $(CH_2)_m COAr^3$ 、 $(CH_2)_m CONR^3 R^4$ 、 $(CH_2)_m Ar^3$ 、 $(CH_2)_3 Ar^3$ 、 $(CH_2)_n NR^3 R^4$ または $(CH_2)_n OR^4$ から選択される；

各 R^3 は独立して、 H または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、 H 、低級アルキルまたは $(CH_2)_p Ar^3$ から選択される；

m は 1 または 2 である；

n は 2 または 3 である；

p は 0 または 1 である；

各 Ar^3 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであって、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 の各置換基は、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)_2 OR^5$ 、 $NR^5 R^6$ 、シクロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O) OR^5$ 、 $C(O) NR^5 R^6$ 、 $OC(O) NR^5 R^6$ 、 $NR^5 C(O) NR^5 R^6$ 、 $C(NR^6) NR^5 R^6$ 、 $NR^5 C(NR^6) NR^5 R^6$ 、 $S(O)_2 NR^5 R^6$ 、 R^7 、 $C(O) R^7$ 、 $NR^5 C(O) R^7$ 、 $S(O) R^7$ または $S(O)_2 R^7$ から独立して選択される；

各 R^5 は独立して、水素またはハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノもしくは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_p Ar^4$ 、またはハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノもしくは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、 $(CH_2)_p Ar^4$ またはハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノもしくは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は独立して、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは、ハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは 1, 2-メチレンジオキシから独立して

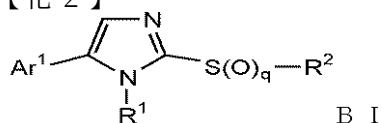
50

選択される 1 ～ 3 個の置換基で置換されていてもよい)
で示される化合物またはその医薬的塩。

【請求項 2】

式 (B I) :

【化 2】



(式中、

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、
それぞれは、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、
アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モ
ノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキ
シ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよ
い；

R^1 は、 Ar^2 または Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール
から選択され、それぞれは、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カル
ボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、
アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル
、ハロアルコキシおよびアルカノイルからなる群から選択される 1 個以上の置換基で置換
されていてもよい；

q は 0、1 または 2 である；

各 R^2 は、独立して、 $(CH_2)_m CO_2 R^3$ 、 $(CH_2)_m CO Ar^3$ 、 $(CH_2)_m$
 $CONR^3 R^4$ 、 $(CH_2)_m Ar^3$ 、 $(CH_2)_3 Ar^3$ 、 $(CH_2)_n NR^3 R^4$ ま
たは $(CH_2)_n OR^4$ から選択される；

各 R^3 は独立して、H または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキルまたは $(CH_2)_p Ar^3$ から選択される；

各 Ar^3 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり
、それぞれは、1 以上の置換基で置換されていてもよい：ただし、 Ar^3 はピペリジニル
、テトラヒドロキノリニルまたはテトラヒドロイソキノリニル以外である；

各 Z は独立して、O または NR^3 から選択される；

各 m は 1 または 2 である；

各 n は 2 または 3 である；

各 p は 0 または 1 である；

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 の各置換基は独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 OR^5 、
 SR^5 、 $S(O)_2 OR^5$ 、 $NR^5 R^6$ 、シクロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアル
キル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O) OR^5$
、 $C(O) NR^5 R^6$ 、 $OC(O) NR^5 R^6$ 、 $NR^5 C(O) NR^5 R^6$ 、 $C(NR^6$
) $NR^5 R^6$ 、 $NR^5 C(NR^6) NR^5 R^6$ 、 $S(O)_2 NR^5 R^6$ 、 R^7 、 $C(O)$
 R^7 、 $NR^5 C(O) R^7$ 、 $S(O) R^7$ または $S(O)_2 R^7$ から選択される；

各 R^5 は独立して、水素または、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 C_1
- C_4 アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノもしくは $C_3 - C_6$ シクロアルキル
から独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択さ
れる；

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_p Ar^4$ またはハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコ
キシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノもしくは $C_3 -$
 C_6 シクロアルキルから選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキル
から選択される；

10

20

30

40

50

各 R^7 は独立して、 $(CH_2)_p Ar^4$ または、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノもしくは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は独立して、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは 1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい)

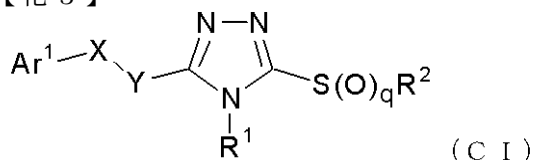
で示される化合物またはその医薬的塩。

【請求項 3】

10

対象者において疾患または病徴を治療する方法であって、対象者に有効量の式 C I の化合物：

【化 3】



(式中、

20

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

X は、 NR^3 、 $C(R^3)_2$ 、S、結合または O であるか、あるいは Y と一緒になって $-CH=CH-$ を形成する；

Y は、 $C=O$ 、結合または低級アルキルであるか、あるいは X と一緒になって、 $-CH=CH-$ を形成する；

R^1 は、 Ar^2 、アルケニル、または Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

30

q は 0、1 または 2 である；

各 R^2 は独立して、 $(CH_2)_m CO_2 R^3$ 、 $(CH_2)_m CO Ar^3$ 、 $(CH_2)_m CONR^3 R^4$ 、 $(CH_2)_m Ar^3$ 、 $(CH_2)_3 Ar^3$ 、 $(CH_2)_n NR^3 R^4$ 、 $(CH_2)_n OR^4$ ； $(CH_2)_m CN$ ；アルキル；アルキニル、 $(CR^3 R^3)_m CONR^3 R^4$ 、 Ar^4 、 $(CR^3 R^3)_m N(R^3)C(O)Ar^3$ または $(CH_2)_m C(NO H)NH_2$ から選択される；

各 R^3 は独立して、H または低級アルキルである；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、アルコキシ、 $(CH_2)_n NR^5 R^6$ または $(CH_2)_p Ar^3$ である；

m は 1 または 2 である；

40

n は 2 または 3 である；

p は 0 または 1 である；

各 Ar^3 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)_2 OR^5$ 、 $NR^5 R^6$ 、シクロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5 R^6$ 、 $OC(O)NR^5 R^6$ 、 $NR^5 C(O)NR^5 R^6$ 、 $C(NR^6)NR^5 R^6$ 、 $NR^5 C(NR^6)NR^5 R^6$ 、 $S(O)_2 NR^5 R^6$ 、 R^7 、 $C(O)R^7$ 、 $NR^5 C(O)R^7$ 、 $S(O)R^7$ または $S(O)_2 R^7$ から選択される；

50

各 R^5 は独立して、水素、またはハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノもしくは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_p Ar^4$ 、またはハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノもしくは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 R^7 は独立して、 $(CH_2)_p Ar^4$ またはハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノもしくは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルである；

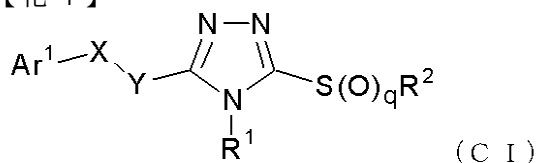
各 Ar^4 は独立して、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、ヘテロサイクリル、アリールまたはヘテロアリールであり、それぞれはハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは 1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい

またはその医薬的塩を投与することを含む方法。

【請求項 4】

式 C I：

【化 4】



(式中、

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよく、それぞれは炭素原子により X と結合している；

X は CH_2 である；

Y は結合である；

R^1 は、 Ar^2 、アルケニル、または Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

q は 0、1 または 2 である；

各 R^2 は独立して、 $(CH_2)_m CO_2 R^3$ 、 $(CH_2)_m CO Ar^3$ または $(CH_2)_m CONR^3 R^4$ である；

各 R^3 は独立して、H または低級アルキルである；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、アルコキシ、 $(CH_2)_n NR^5 R^6$ または $(CH_2)_p Ar^3$ である；

m は 2 である；

n は 2 または 3 である；

p は 0 または 1 である；

各 Ar^3 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)_2 OR^5$ 、 $NR^5 R^6$ 、シクロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5 R^6$ 、 $OC(O)NR^5 R^6$ 、 $NR^5 C(O)NR^5 R^6$ 、 $C(NR^5 R^6)$

^{6}) $\text{NR}^5 \text{R}^6$ 、 $\text{NR}^5 \text{C}(\text{NR}^6) \text{NR}^5 \text{R}^6$ 、 $\text{S}(\text{O})_2 \text{NR}^5 \text{R}^6$ 、 R^7 、 $\text{C}(\text{O}) \text{R}^7$ 、 $\text{NR}^5 \text{C}(\text{O}) \text{R}^7$ 、 $\text{S}(\text{O}) \text{R}^7$ または $\text{S}(\text{O})_2 \text{R}^7$ である；

各 R^5 は独立して、水素、またはハロゲン、 OH 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノもしくは $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 R^6 は独立して、水素、 $(\text{CH}_2)_p \text{Ar}^4$ 、またはハロゲン、 OH 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノもしくは $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 R^7 は独立して、 $(\text{CH}_2)_p \text{Ar}^4$ 、またはハロゲン、 OH 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノもしくは $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルである；

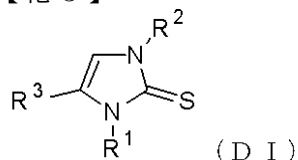
各 Ar^4 は独立して、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキル、ヘテロサイクリル、アリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは、ハロゲン、 OH 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノまたは 1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい

で示される化合物またはその医薬的塩。

【請求項 5】

式 (D I)：

【化 5】



(式中、

R^3 は、 Ar^1 または $\text{Ar}^1 - \text{X} - \text{Y}$ であり、ここにおいて、

各 Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

X は、 NR^4 、 $\text{C}(\text{R}^4)_2$ または O である；

Y は、 $\text{C}=\text{O}$ または低級アルキルである；

R^1 は、 Ar^2 、または Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は独立して、 $(\text{CH}_2)_m \text{C}(\text{O}) \text{OR}^4$ 、 $(\text{CH}_2)_m \text{C}(\text{O}) \text{Ar}^3$ 、 $(\text{CH}_2)_m \text{C}(\text{O}) \text{NR}^4 \text{R}^5$ 、 $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^4 \text{R}^5$ 、 $(\text{CH}_2)_3 \text{Ar}^3$ または $(\text{CH}_2)_m \text{Ar}^3$ から選択される；

各 R^4 は独立して、 H または低級アルキルから選択される；

各 R^5 は独立して、 H 、低級アルキルまたは $(\text{CH}_2)_p \text{Ar}^3$ から選択される；

m は 1 または 2 である；

n は 2 または 3 である；

p は 0 または 1 である；

各 Ar^3 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 OR^6 、 SR^6 、 $\text{S}(\text{O})_2 \text{OR}^6$ 、 $\text{NR}^6 \text{R}^7$ 、シクロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_2$ パーフフルオロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $\text{C}(\text{O}) \text{OR}^6$ 、 $\text{C}(\text{O}) \text{NR}^6 \text{R}^7$ 、 $\text{OC}(\text{O}) \text{NR}^6 \text{R}^7$ 、 $\text{NR}^6 \text{C}(\text{O}) \text{NR}^6 \text{R}^7$ 、 $\text{C}(\text{NR}^6 \text{R}^7)$

10

20

30

40

50

^{6}) $\text{NR}^6 \text{R}^7$ 、 $\text{NR}^6 \text{C}(\text{NR}^7) \text{NR}^6 \text{R}^7$ 、 $\text{S}(\text{O})_2 \text{NR}^6 \text{R}^7$ 、 R^8 、 $\text{C}(\text{O}) \text{R}^8$ 、 $\text{NR}^6 \text{C}(\text{O}) \text{R}^8$ 、 $\text{S}(\text{O}) \text{R}^8$ または $\text{S}(\text{O})_2 \text{R}^8$ から選択される；

各 R^6 は独立して、水素、またはハロゲン、 OH 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノもしくは $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、水素、 $(\text{CH}_2)_q \text{Ar}^4$ 、またはハロゲン、 OH 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノもしくは $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^8 は独立して、 $(\text{CH}_2)_q \text{Ar}^4$ 、またはハロゲン、 OH 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノもしくは $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は独立して、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは、ハロゲン、 OH 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノまたは $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい；

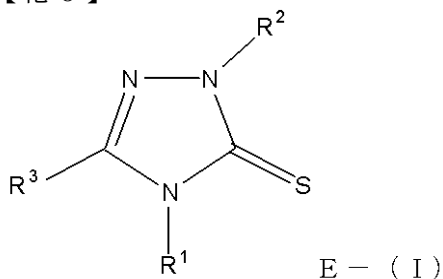
q は 0 または 1 である）

で示される化合物またはその医薬的塩。

【請求項 6】

式 (E I)：

【化 6】



(式中、

R^3 は、アルキル、アルコシアルキル、 Ar^1 または $\text{Ar}^1 - \text{X} - \text{Y}$ であり、ここにおいて、

各 Ar^1 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

X は、 NR^4 、 $\text{C}(\text{R}^4)_2$ または O である；

Y は、 $\text{C}=\text{O}$ または低級アルキルである；

R^1 は、 H 、アルケニル、 Ar^2 、または Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は独立して、 H 、 $(\text{CH}_2)_m \text{C}(\text{O}) \text{OR}^4$ 、 $(\text{CH}_2)_m \text{C}(\text{O}) \text{Ar}^3$ 、 $(\text{CH}_2)_m \text{C}(\text{O}) \text{NR}^4 \text{R}^5$ 、 $(\text{CH}_2)_m \text{C}(\text{O}) \text{N}(\text{OR}^4) \text{R}^5$ 、 $(\text{CH}_2)_m \text{CH}_2 \text{OR}^4$ 、 Ar^3 、 $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^4 \text{R}^5$ または $(\text{CH}_2)_m \text{Ar}^3$ から選択される；

各 R^4 は独立して、 H または低級アルキルから選択される；

各 R^5 は独立して、 H 、低級アルキルまたは $(\text{CH}_2)_p \text{Ar}^3$ から選択される；

m は 1 または 2 である；

10

20

30

40

50

n は 2 または 3 である ;

p は 0 または 1 である ;

各 Ar^3 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい ;

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)_2OR^6$ 、 NR^6R^7 、シクロアルキル、 C_1-C_2 パーフフルオロアルキル、 C_1-C_2 パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O)OR^6$ 、 $C(O)NR^6R^7$ 、 $OC(O)NR^6R^7$ 、 $NR^6C(O)NR^6R^7$ 、 $C(NR^6)NR^6R^7$ 、 $NR^6C(NR^7)NR^6R^7$ 、 $S(O)_2NR^6R^7$ 、 R^8 、 $C(O)R^8$ 、 $NR^6C(O)R^8$ 、 $S(O)R^8$ または $S(O)_2R^8$ から選択される ;

10

各 R^6 は独立して、水素、またはハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノもしくは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される ;

各 R^7 は独立して、水素、 $(CH_2)_qAr^4$ 、またはハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノもしくは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される ;

各 R^8 は独立して、 $(CH_2)_qAr^4$ 、またはハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノもしくは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される ;

20

各 Ar^4 は独立して、 C_3-C_6 シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは、ハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノまたは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい ;

q は 0 または 1 である)

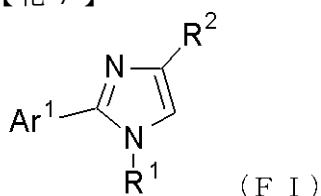
で示される化合物またはその医薬的塩。

【請求項 7】

対象者において疾患または病徴を治療する方法であって、対象者に有効量の式 (F I)

30

【化 7】



(式中、

40

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、そのそれぞれは、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシおよびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい ;

R^1 は、 Ar^2 、または Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである ;

Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、そのそれぞれは、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル

50

ル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシおよびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてよい；

各 R^2 は独立して、 CO_2R^3 、 $COAr^3$ 、 $CONR^3R^4$ 、 Ar^3 、 $CH_2NR^3R^4$ から選択される；

各 R^3 は独立して、H または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 $C(O)R^7$ 、 $S(O)_2R^7$ または $(CH_2)_pAr^3$ から選択される；

各 Ar^3 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてよい； 10

各 p は独立して 0 または 1 である；

Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)_2OR^5$ 、 NR^5R^6 、シクロアルキル、 C_1-C_2 パーフフルオロアルキル、 C_1-C_2 パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $OC(O)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(O)NR^5R^6$ 、 $C(NR^5)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(NR^6)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 R^7 、 $C(O)R^7$ 、 $NR^6C(O)R^7$ 、 $S(O)R^7$ または $S(O)_2R^7$ から選択される；

各 R^5 は独立して、水素、またはハロゲン、 OH 、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノもしくは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてよい低級アルキルから選択される； 20

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_qAr^4$ 、またはハロゲン、 OH 、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノもしくは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、 $(CH_2)_qAr^4$ 、またはハロゲン、 OH 、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノもしくは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてよい低級アルキルから選択される； 30

各 Ar^4 は独立して、 C_3-C_6 シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれはハロゲン、 OH 、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノまたは 1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてよい；

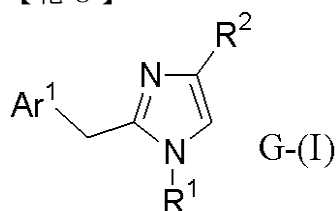
各 q は独立して 0 または 1 である）。

の化合物またはその医薬的な塩を投与することを含む方法

【請求項 8】

式 G-(I)：

【化 8】



(式中、

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、そのそれぞれは H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコ 30

キシおよびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は、 Ar^2 、または Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、そのそれぞれは H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシおよびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は独立して、 CO_2R^3 、 $COAr^3$ 、 $CONR^3R^4$ 、 $(CH_2)_mAr^3$ 、 $(CH_2)_nNR^3R^4$ または CH_2OR^4 から選択される； 10

各 R^3 は独立して、H または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 $C(O)R^7$ 、 $S(O)_2R^7$ または $(CH_2)_pAr^3$ から選択される；

各 Ar^3 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 m は独立して、0 または 1 である；

各 n は独立して、1 または 2 である；

各 p は独立して、0 または 1 である； 20

Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)_2OR^5$ 、 NR^5R^6 、シクロアルキル、 C_1-C_2 パーフフルオロアルキル、 C_1-C_2 パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $OC(O)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(O)NR^5R^6$ 、 $C(NR^5)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(NR^6)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 R^7 、 $C(O)R^7$ 、 $NR^6C(O)R^7$ 、 $S(O)R^7$ または $S(O)_2R^7$ から選択される；

各 R^5 は独立して、水素、またはハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノもしくは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される； 30

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_qAr^4$ 、またはハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノもしくは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、 $(CH_2)_qAr^4$ またはハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノまたは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は独立して、 C_3-C_6 シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは、ハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノまたは 1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1~3 個の置換基で置換されていてもよい； 40

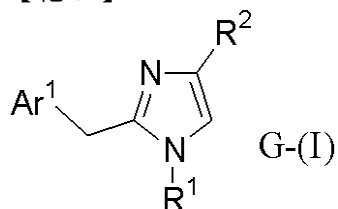
各 q は独立して 0 または 1 である）

で示されるまたはその医薬的塩。

【請求項 9】

対象者において疾患または病徴を治療する方法であって、有効量の式 G-(I)：

【化 9】



(式中、

Ar¹ は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、
 それぞれはH、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノ
 およびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ
 、およびアルカノイルからなる群から選択される1以上の置換基で置換されていてもよい
 ;

R¹ は、Ar²、またはAr²で置換されていてもよい低級アルキルである；

Ar² は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール
 から選択され、それぞれはH、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボ
 キシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アル
 コキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、
 ハロアルコキシおよびアルカノイルからなる群から選択される1以上の置換基で置換され
 ていてもよい；

各R² は独立して、CO₂R³、COAr³、CONR³R⁴、(CH₂)_mAr³、(CH₂)_nNR³R⁴またはCH₂OR⁴から選択される；

各R³ は独立して、Hまたは低級アルキルから選択される；

各R⁴ は独立して、H、低級アルキル、C(O)OR⁵、C(O)NR⁵R⁶、S(O)₂NR⁵R⁶、C(O)R⁷、S(O)₂R⁷または(CH₂)_pAr³から選択される
 ；

各Ar³ は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリール
 であり、それぞれは1以上の置換基で置換されていてもよい；

各mは、独立して0または1である；

各nは、独立して1または2である；

各pは、独立して0または1である；

Ar³の各置換基は独立して、ハロゲン、CN、NO₂、OR⁵、SR⁵、S(O)₂OR⁵、NR⁵R⁶、シクロアルキル、C₁-C₂パーフルオロアルキル、C₁-C₂パー
 フルオロアルコキシ、1,2-メチレンジオキシ、C(O)OR⁵、C(O)NR⁵R⁶、OC(O)NR⁵R⁶、NR⁵C(O)NR⁵R⁶、C(NR⁵)NR⁵R⁶、NR⁵
 C(NR⁶)NR⁵R⁶、S(O)₂NR⁵R⁶、R⁷、C(O)R⁷、NR⁶C(O)
 R⁷、S(O)R⁷またはS(O)₂R⁷から選択される；

各R⁵ は独立して、水素、またはハロゲン、OH、C₁-C₄アルコキシ、NH₂、C₁-
 C₄アルキルアミノ、C₁-C₄ジアルキルアミノもしくはC₃-C₆シクロアルキル
 から独立して選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択さ
 れる；

各R⁶ は独立して、水素、(CH₂)_qAr⁴、またはハロゲン、OH、C₁-C₄アル
 コキシ、NH₂、C₁-C₄アルキルアミノ、C₁-C₄ジアルキルアミノもしくはC₃-
 C₆シクロアルキルから独立して選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低
 級アルキルから選択される；

各R⁷ は独立して、(CH₂)_qAr⁴またはハロゲン、OH、C₁-C₄アルコキシ、
 NH₂、C₁-C₄アルキルアミノ、C₁-C₄ジアルキルアミノもしくはC₃-C₆シ
 クロアルキルから独立して選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキ
 ルから選択される；

10

20

30

40

50

各 Ar^4 は独立して、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれはハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノもしくは 1, 2-メチレンジオキシから選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい；

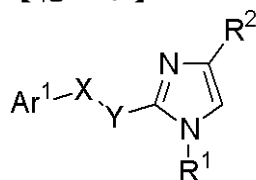
各 q は独立して 0 または 1 である）

で示される化合物またはその医薬的塩を対象者に投与することを含む方法。

【請求項 10】

式 H - (I) :

【化 10】



H-(I)

10

(式中、

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、そのそれぞれは、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシおよびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

20

X は、 NR^3 、 $C(R^3)_2$ または O である；

Y は、 $C=O$ または低級アルキルである；

R^1 は、 Ar^2 または Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシおよびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

30

各 R^2 は独立して、 CO_2R^3 、 $COAr^3$ 、 $CONR^3R^4$ 、 $(CH_2)_mAr^3$ 、 $CH_2NR^3R^4$ または CH_2OR^4 から選択される；

各 R^3 は独立して、H または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、H 低級アルキル、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 $C(O)R^7$ 、 $S(O)_2R^7$ または $(CH_2)_pAr^3$ から選択される；

各 Ar^3 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 m は独立して 0 または 1 である；

各 p は独立して 0 または 1 である；

Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)_2OR^5$ 、 NR^5R^6 、シクロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $OC(O)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(O)NR^5R^6$ 、 $C(NR^5)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(NR^6)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 R^7 、 $C(O)R^7$ 、 $NR^6C(O)R^7$ 、 $S(O)R^7$ または $S(O)_2R^7$ から選択される；

40

各 R^5 は独立して、水素、またはハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノもしくは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_qAr^4$ 、またはハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アル

50

コキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノもしくは $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、 $(\text{CH}_2)_q \text{Ar}^4$ またはハロゲン、 OH 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノもしくは $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は独立して、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれはハロゲン、 OH 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノまたは 1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい；

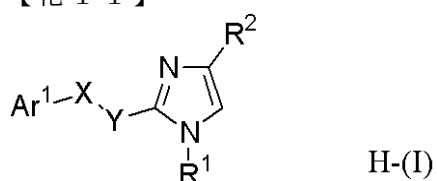
各 q は独立して 0 または 1 である）

で示される化合物またはその医薬的塩。

【請求項 11】

対象者において疾患または病徴を治療する方法であって、対象者に有効量の式 H-(I)：

【化 11】



(式中、

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、それぞれは、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシおよびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

X は、 NR^3 、 $\text{C}(\text{R}^3)_2$ または O である；

Y は、 $\text{C}=\text{O}$ または低級アルキルである；

R^1 は、 Ar^2 または、 Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

Ar^2 は、独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシおよびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は独立して、 CO_2R^3 、 COAr^3 、 CONR^3R^4 、 $(\text{CH}_2)_m\text{Ar}^3$ 、 $\text{CH}_2\text{NR}^3\text{R}^4$ または CH_2OR^4 から選択される；

各 R^3 は独立して、H または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^7$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^7$ または $(\text{CH}_2)_p\text{Ar}^3$ から選択される；

各 Ar^3 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 m は独立して 0 または 1 である；

各 p は独立して 0 または 1 である；

Ar^3 の各置換基は独立して、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 OR^5 、 SR^5 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^5$ 、 NR^5R^6 、シクロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_2$ パーフフルオロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_2$ パー

フルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $OC(O)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(O)NR^5R^6$ 、 $C(NR^5)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(NR^6)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 R^7 、 $C(O)R^7$ 、 $NR^6C(O)R^7$ 、 $S(O)R^7$ または $S(O)_2R^7$ から選択される；

各 R^5 は独立して、水素、またはハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノもしくは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_qAr^4$ 、またはハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノもしくは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、 $(CH_2)_qAr^4$ 、またはハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノもしくは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は独立して、 C_3-C_6 シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれはハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノまたは 1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

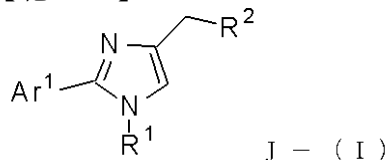
各 q は独立して 0 または 1 である）

で示される化合物またはその医薬的塩を投与することを含む方法。

【請求項 12】

式 J - (I)：

【化 12】



(式中、

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は、 Ar^2 、または Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 Ar^2 は、独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は独立して、 $(CH_2)_mCO_2R^3$ 、 $(CH_2)_mCOAr^3$ 、 $(CH_2)_mCONR^3R^4$ 、 $(CH_2)_mAr^3$ または $(CH_2)_nNR^3R^4$ から選択される；

各 R^3 は独立して、H または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 $C(O)R^7$ 、 $S(O)_2R^7$ または $(CH_2)_pAr^3$ から選択される；あるいは

各 R^3 および R^4 は、これらがどちらも結合している窒素原子と一緒にあって 4～7 員複素環を形成する（ここにおいて、各複素環における 1 つの炭素原子は、 NR^4 、O または S であり、各複素環は 1 以上の低級アルキル基で置換されていてもよい）；

各 Ar^3 は、独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、それぞれは 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 m は独立して 0 または 1 である；

各 n は独立して 1 または 2 である；

10

20

30

40

50

各 p は独立して 0 または 1 である；

Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)_2$ 、 OR^5 、 NR^5R^6 、シクロアルキル、 C_1-C_2 パーフフルオロアルキル、 C_1-C_2 パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $OC(O)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(O)NR^5R^6$ 、 $C(NR^5)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(NR^6)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 R^7 、 $C(O)R^7$ 、 $NR^6C(O)R^7$ 、 $S(O)R^7$ または $S(O)_2R^7$ から選択される；

各 R^5 は独立して、水素、またはハロゲン、 OH 、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノもしくは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される； 10

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_pAr^4$ 、またはハロゲン、 OH 、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノもしくは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、 $(CH_2)_pAr^4$ 、またはハロゲン、 OH 、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノもしくは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

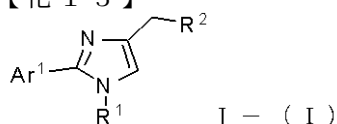
各 Ar^4 は独立して、 C_3-C_6 シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれはハロゲン、 OH 、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノまたは 1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい) 20

で示される化合物またはその医薬的塩。

【請求項 13】

請求項 12 における式 J - (I)：

【化 13】



30

(式中、

Ar^1 は、アリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは 1～3 個の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は Ar^2 である；

各 Ar^2 は独立して、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは 1～3 個の置換基で置換されていてもよい；

R^2 は $(CH_2)_nNR^3R^4$ であり、 n は 1 である。ここにおいて、

各 R^4 は独立して、 H 、低級アルキル、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 $C(O)R^7$ 、 $S(O)_2R^7$ または $(CH_2)_pAr^3$ から選択されるか；または 40

各 R^3 および R^4 はそれらがどちらも結合している窒素原子と一緒にあって、4～7 員複素環を形成する。ここにおいて、

各複素環における 1 つの炭素原子は、 NR^4 、 O または S であり、各複素環は 1 または 2 個の低級アルキル基で置換されていてもよい；

各 p は 0 または 1 である；

各 Ar^3 は独立して、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは 1～3 個の置換基で置換されていてもよい)

で示される化合物。

【請求項 14】

50

本明細書の表 A ～ J に記載されている請求項 1 ～ 13 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【請求項 15】

カルシウムチャンネル活性を抑制する方法であって、請求項 1 ～ 14 のいずれか 1 つに記載の化合物をカルシウムチャンネルと接触させることを含む方法。

【請求項 16】

対象者においてカルシウムチャンネル活性を抑制する方法であって、前記対象者に有効量の請求項 1 ～ 14 のいずれか 1 つに記載の化合物を投与することを含む方法。

【請求項 17】

対象者においてカルシウムチャンネルが介在する疾患を治療する方法であって、前記対象者に有効量の請求項 1 ～ 14 のいずれか 1 つに記載の化合物を投与することを含む方法 10

【請求項 18】

カルシウムチャンネルが Ca_v1 である請求項 15 ～ 17 のいずれか 1 つに記載の方法。

【請求項 19】

カルシウムチャンネルが $Ca_v1.2$ または $Ca_v1.3$ である請求項 15 ～ 17 のいずれか 1 つに記載の方法。

【請求項 20】

Ca_v1 カルシウムチャンネルが介在する疾患または病徴が、認識機能または神経系疾患または病徴である請求項 17 記載の方法。 20

【請求項 21】

$Ca_v1.2$ または $Ca_v1.3$ カルシウムチャンネルが介在する疾患または病徴が、認識機能、または神経系疾患、または病徴である請求項 17 記載の方法。

【請求項 22】

Ca_v1 カルシウムチャンネルが介在する疾患または病徴が心血管疾患または病徴である請求項 17 記載の方法。

【請求項 23】

$Ca_v1.2$ または $Ca_v1.3$ カルシウムチャンネルが介在する疾患または病徴が心血管疾患または病徴である請求項 17 記載の方法。

【請求項 24】

対象者における Ca_v1 カルシウムチャンネルが介在する狭心症、鬱血性心不全または心筋虚血の治療法であって、有効量の請求項 1 ～ 14 のいずれか 1 つに記載の化合物を投与することを含む方法。 30

【請求項 25】

Ca_v1 カルシウムチャンネルが $Ca_v1.2$ または $Ca_v1.3$ である請求項 24 記載の方法。

【請求項 26】

対象者における Ca_v1 カルシウムチャンネルが介在する尿失禁または過活動膀胱を治療する方法であって、有効量の請求項 1 ～ 14 のいずれか 1 つに記載の化合物を対象者に投与することを含む方法。 40

【請求項 27】

Ca_v1 カルシウムチャンネルが $Ca_v1.2$ または $Ca_v1.3$ である請求項 26 記載の方法。

【請求項 28】

対象者において Ca_v1 カルシウムチャンネル心房性細動を治療する方法であって、有効量の請求項 1 ～ 14 のいずれか 1 つに記載の化合物を対象者に投与することを含む方法。

【請求項 29】

Ca_v1 カルシウムチャンネルが $Ca_v1.2$ または $Ca_v1.3$ である請求項 28 記載の方法。 50

【請求項 30】

対象者における $\text{Ca}_v 1$ カルシウムチャンネルが介在する高血圧を治療する方法であって、有効量の請求項 1～14 のいずれか 1 つに記載の化合物を対象者に投与することを含む方法。

【請求項 31】

$\text{Ca}_v 1$ カルシウムチャンネルが $\text{Ca}_v 1.2$ または $\text{Ca}_v 1.3$ である請求項 30 記載の方法。

【請求項 32】

請求項 1～14 の化合物を調製する方法であって、本明細書において示される中間体化合物を試薬と反応させて、本明細書において定義するような請求項 1～14 のいずれか 1 つに記載の化合物を得ることを含む方法。

10

【請求項 33】

請求項 1～14 のいずれか 1 つに記載の化合物および医薬的に許容される担体を含む組成物。

【請求項 34】

追加の治療薬をさらに含む請求項 33 記載の組成物。

【請求項 35】

対象者において疾患または病徴を治療する方法であって、有効量の請求項 1～14 のいずれか 1 つに記載の化合物を、かかる治療を必要とする対象者に投与することを含む方法。

20

【請求項 36】

疾患または病徴が、狭心症、高血圧、鬱血性心不全、心筋虚血、心房性細動、真性糖尿病、尿失禁、過活動膀胱、肺病、認識機能または神経系障害である請求項 35 記載の方法。

【発明の詳細な説明】

【発明の詳細な記載】

【0001】

全ての細胞は、細胞膜を横切る無機イオンの制御された動きに依存し、本質的な生理学的機能をする。電気興奮性、シナプス可塑性、およびシグナル伝達は、イオン濃度の変化が重要な役割を果たすプロセスの例である。一般に、これらの変化を許容するイオンチャンネルは、1 または複数のサブユニットからなるタンパク質孔であり、それぞれは、2 以上の膜貫通ドメインを含有する。殆どのイオンチャンネルは、サイズおよび電荷についての物理的優先傾向のために、特定のイオン、主に Na^+ 、 K^+ 、 Ca^{2+} または Cl^- に対して選択性を有する。能動輸送よりも、電気化学力が膜を横切ってイオンを推進し、かくして 1 つのチャンネルが 1 秒当たり数百万のイオンの通過を可能にする。チャンネルの開口、すなわち「通門 (gating)」は、チャンネルのサブクラスに応じて、電圧における変化によるか、またはリガンド結合により、嚴重に抑制される。イオンチャンネルは、多くの生理学的プロセスに関与するので、魅力的な治療標的であるが、特定の組織タイプにおける特定のチャンネルについての特異性を有する医薬の調製は依然として主な課題である。

30

40

【0002】

電位依存性イオンチャンネルは、膜電位の変化に応じて開く。例えば、興奮性細胞、例えば、ニューロンの脱分極の結果、 Na^+ イオンの一時的流入が起こり、これは神経インパルスを増大させる。このような Na^+ 濃度における変化は、電位依存性 K^+ チャンネルにより察知され、次に K^+ イオンを流出させる。 K^+ イオンの流出は、膜を再分極化させる。他の細胞タイプは、電位依存性 Ca^{2+} チャンネルに依存し、活動電位を生じる。電位依存性イオンチャンネルは、非興奮性細胞においても、分泌の制御、恒常性、および有糸分裂促進プロセスなどにおいて重要な働きをする。リガンド依存性イオンチャンネルは、細胞外刺激、例えば、神経伝達物質（例えば、グルタメート、セロトニン、アセチルコリン）または細胞内刺激（例えば、 cAMP 、 Ca^{2+} 、およびリン酸化）により開くこ

50

とができる。

【0003】

電位依存性カルシウムチャンネルの Ca_v1 ファミリーは、4つの主なサブタイプ、 $Ca_v1.1$ 、 $Ca_v1.2$ 、 $Ca_v1.3$ および $Ca_v1.4$ からなる。これらの流れは、主に、 $Ca_v1.1$ については骨格筋、 $Ca_v1.2$ については心臓、平滑筋、脳、下垂体および副腎組織、 $Ca_v1.3$ については脳、脾臓、心臓、腎臓、卵巣および蝸牛、そして $Ca_v1.4$ については網膜において見いだされる。これらの流れは、活性化のために強力な脱分極を必要とし、長時間持続する。 $Ca_v1.1$ チャンネルのサブユニット組成物は、孔を形成し、電圧感知性ゲート($\alpha_{1.1.1}$ 、 $\alpha_{1.1.2}$ 、 $\alpha_{1.1.3}$ および $\alpha_{1.1.4}$ 、それぞれ α_{1S} 、 α_{1C} 、 α_{1D} 、および α_{1F} ともいう)を含有するその α_1 サブユニット、ならびに β 、 $\alpha_2\delta$ および γ サブユニットにより規定される。

10

【0004】

イオンチャンネル機能における遺伝子的または薬理的摂動は、劇的な臨床的結果を有し得る。QT延長症候群、癲癇、嚢胞性線維症、および一過性運動失調症は、イオンチャンネルサブユニットにおける突然変異の結果の遺伝性疾患の数例である。有害な副作用、例えば、不整脈および癲癇発作は、ある種の医薬により引き起こされるが、イオンチャンネル機能障害による(Sirois, J. E. および, Atchison, W. D., Neurotoxicology 1996; 17(1): 63-84; Keating, M. T., Science 1996 272: 681-685)。医薬は、イオンチャンネル活性の治療的調節に有用であり、高血圧、狭心症、心筋虚血、喘息、過活動膀胱、脱毛症、疼痛、心不全、月経困難症、II型糖尿病、不整脈、移植片拒絶、癲癇発作、痙攣、癲癇、卒中、胃運動亢進症、精神病、癌、筋ジストロフィー、およびナルコレプシーをはじめとする多く病的状態の治療において使用される(Coghlan, M. J. ら、J. Med. Chem. 2001, 44: 1627-1653; Ackerman, M. J., および Clapham, D. E. N. Eng. J. Med. 1997, 336: 1575-1586)。より多くの同定されたイオンチャンネルおよびその複雑さの理解は、イオンチャンネル機能を変更する治療での今後の取り組みにおいて役立つであろう。

20

【0005】

過活動膀胱(OAB)は、膀胱における排尿筋の過活動の結果起こる貯蔵症状、例えば、尿意逼迫、頻尿および夜尿症(急迫性尿失禁を伴うかまたは伴わない)により特徴づけられる。OABは、急迫性尿失禁につながり得る。OABおよび膀胱痛症候群の病因はわからないが、神経、平滑筋および尿路上皮の障害がOABを引き起こし得る(Steers, W. Rev Urol, 4: S7-S18)。膀胱過活動の低下は、 $Ca_v2.2$ および/または Ca_v1 チャンネルの阻害により間接的に影響を受け得ることを示唆する証拠がある。

30

【非特許文献1】Sirois, J. E. および, Atchison, W. D., Neurotoxicology 1996; 17(1): 63-84; Keating, M. T., Science 1996 272: 681-685

【非特許文献2】Coghlan, M. J. ら、J. Med. Chem. 2001, 44: 1627-1653

40

【非特許文献3】Ackerman, M. J., および Clapham, D. E. N. Eng. J. Med. 1997, 336: 1575-1586

【非特許文献4】Steers, W. Rev Urol, 4: S7-S18

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0006】

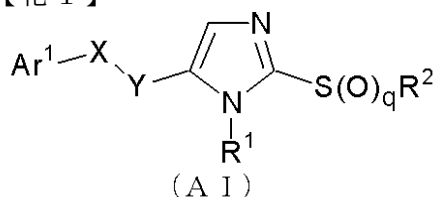
本発明は、複素環式化合物、前記化合物を含む組成物、および前記化合物および化合物組成物の使用法に関する。この化合物およびこれを含む組成物は、イオンチャンネルが存在するか、イオンチャンネルに関連するものをはじめとする疾患または病徴の治療に有用である。

50

【0007】

一態様は、式(A I)の化合物またはその医薬的塩である：

【化1】



10

(式中、

Ar^1 はシクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであって、それぞれは所望により1以上の置換基で置換されていてもよい；

X は NR^3 、 $C(R^3)_2$ または O である；

Y は $C=O$ または低級アルキルである；

R^1 は、 Ar^2 または所望により Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであって、それぞれ1以上の置換基で所望により置換されていてもよい；

q は 0、1 または 2 である；

各 R^2 は独立して、 $(CH_2)_m CO_2 R^3$ 、 $(CH_2)_m CO Ar^3$ 、 $(CH_2)_m CONR^3 R^4$ 、 $(CH_2)_m Ar^3$ 、 $(CH_2)_3 Ar^3$ 、 $(CH_2)_n NR^3 R^4$ または $(CH_2)_n OR^4$ から選択される； 20

各 R^3 は独立して、 H 、または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、 H 、低級アルキルまたは $(CH_2)_p Ar^3$ から選択される；

m は 1 または 2 である；

n は 2 または 3 である；

p は 0 または 1 である；

各 Ar^3 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであって、それぞれは所望により1以上の置換基で置換されていてもよい；

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 の各置換基は、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)_2 OR^5$ 、 $NR^5 R^6$ 、シクロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O) OR^5$ 、 $C(O) NR^5 R^6$ 、 $OC(O) NR^5 R^6$ 、 $NR^5 C(O) NR^5 R^6$ 、 $C(NR^6) NR^5 R^6$ 、 $NR^5 C(NR^6) NR^5 R^6$ 、 $S(O)_2 NR^5 R^6$ 、 R^7 、 $C(O) R^7$ 、 $NR^5 C(O) R^7$ 、 $S(O) R^7$ 、または $S(O)_2 R^7$ から独立して選択される； 30

各 R^5 は独立して、水素または所望により、ハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_p Ar^4$ 、または所望により、ハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される； 40

各 R^7 は独立して、 $(CH_2)_p Ar^4$ または所望により、ハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は独立して、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは 1, 2-メチレンジオキシか 50

ら独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい)。

【0008】

他の態様において、化合物は、本明細書における任意の式を有するもの(その任意の組み合わせを包含する)であり：

ここにおいて、

Ar^1 は、アリール、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

X は NR^3 である；

Y は $C=O$ である；

ここにおいて、 R^1 はアリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい； 10

ここにおいて、各 R^2 は独立して、 $(CH_2)_m Ar^3$ である；

各 Ar^3 は、所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよいヘテロアリールである；

ここにおいて、 Ar^3 は、所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい、炭素原子および 1、2、または 3 個の、N、O および S から選択されるヘテロ原子を有する 5 員環を含むヘテロアリールである；

ここにおいて、 Ar^3 は、ピロリジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾキサゾリル、またはベンズチアゾリルであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、各 R^2 は、 $(CH_2)_n NR^3 R^4$ であり、ここにおいて、各 R^4 は独立して $(CH_2)_p Ar^3$ である； 20

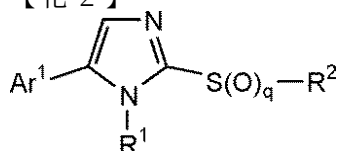
ここにおいて、 R^3 は H である；

ここにおいて、式 A I の化合物は、本明細書における任意の表において記載される化合物、またはその医薬的塩である。

【0009】

一態様は、式 (B I) の化合物またはその医薬的塩である：

【化 2】



30

(式中、

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、そのそれぞれは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は、 Ar^2 または所望により Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、そのそれぞれは、所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 個以上の置換基で置換されていてもよい； 40

q は 0、1 または 2 である；

各 R^2 は、独立して、 $(CH_2)_m CO_2 R^3$ 、 $(CH_2)_m CO Ar^3$ 、 $(CH_2)_m CONR^3 R^4$ 、 $(CH_2)_m Ar^3$ 、 $(CH_2)_3 Ar^3$ 、 $(CH_2)_n NR^3 R^4$ または $(CH_2)_n OR^4$ から選択される；

各 R^3 は独立して、H、または低級アルキルから選択される； 50

各 R^4 は独立して、H、低級アルキルまたは $(CH_2)_p Ar^3$ から選択される；

各 Ar^3 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、そのそれぞれは、所望により、1以上の置換基で置換されていてもよい。ただし、 Ar^3 はピペリジニル、テトラヒドロキノリニルまたはテトラヒドロイソキノリニルでないとする；

各 Z は独立して、O または NR^3 から選択される；

各 m は 1 または 2 である；

各 n は 2 または 3 である；

各 p は 0 または 1 である；

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 の各置換基は独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)_2 OR^5$ 、 $NR^5 R^6$ 、シクロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O) OR^5$ 、 $C(O) NR^5 R^6$ 、 $OC(O) NR^5 R^6$ 、 $NR^5 C(O) NR^5 R^6$ 、 $C(NR^6) NR^5 R^6$ 、 $NR^5 C(NR^6) NR^5 R^6$ 、 $S(O)_2 NR^5 R^6$ 、 R^7 、 $C(O) R^7$ 、 $NR^5 C(O) R^7$ 、 $S(O) R^7$ 、または $S(O)_2 R^7$ から選択される；

各 R^5 は独立して、水素または、所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_p Ar^4$ 、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、 $(CH_2)_p Ar^4$ または、所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は独立して、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは 1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい。

【0010】

他の態様において、化合物は、本明細書における式の任意のもの（その組み合わせを含む）を有するものであり、

ここにおいて、

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、そのそれぞれは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は、 Ar^2 、または所望により Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

Ar^2 は、独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールから選択され、そのそれぞれは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

q は 0 である；

各 R^2 は独立して、 $(CH_2)_m CO_2 R^3$ 、 $(CH_2)_m CO Ar^3$ 、 $(CH_2)_m C$

ONR^3R^4 、 $(\text{CH}_2)_m\text{Ar}^3$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{Ar}^3$ 、 $(\text{CH}_2)_n\text{NR}^3\text{R}^4$ または $(\text{CH}_2)_n\text{OR}^4$ から選択される；

各 R^3 は独立して、H、または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、または $(\text{CH}_2)_p\text{Ar}^3$ から選択される；

各 Ar^3 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい。ただし、 Ar^3 はピペリジニル、テトラヒドロキノリニルまたはテトラヒドロイソキノリニルでないとする；

各 Z は独立して、O または NR^3 から選択される；

各 m は 1、または 2 である；

各 n は 2 または 3 である；

各 p は 0 または 1 である；

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 はの各置換基は、独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 OR^5 、 SR^5 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{OR}^5$ 、 NR^5R^6 、シクロアルキル、 C_1-C_2 パーフフルオロアルキル、 C_1-C_2 パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $\text{C}(\text{NR}^6)\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{NR}^6)\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^5\text{R}^6$ 、 R^7 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^7$ 、 $\text{NR}^5\text{C}(\text{O})\text{R}^7$ 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}^7$ 、または $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^7$ から選択される；

各 R^5 は独立して、水素、または所望により、ハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノ、または C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^6 は独立して、水素、 $(\text{CH}_2)_p\text{Ar}^4$ 、または所望により、ハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノ、または C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、 $(\text{CH}_2)_p\text{Ar}^4$ または所望により、ハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノ、または C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は独立して、 C_3-C_6 シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノ、または 1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1~3 個の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、そのそれぞれは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は、 Ar^2 、または所望により Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

Ar^2 は、独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールから選択され、そのそれぞれは、所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

q は 1 である；

各 R^2 は独立して、 $(\text{CH}_2)_m\text{CO}_2\text{R}^3$ 、 $(\text{CH}_2)_m\text{COAr}^3$ 、 $(\text{CH}_2)_m\text{CONR}^3\text{R}^4$ 、 $(\text{CH}_2)_m\text{Ar}^3$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{Ar}^3$ 、 $(\text{CH}_2)_n\text{NR}^3\text{R}^4$ また

10

20

30

40

50

は $(CH_2)_n OR^4$ から選択される；

各 R^3 は独立して、H、または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、または $(CH_2)_p Ar^3$ から選択される；

各 Ar^3 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい。ただし、 R^2 が $(CH_2)_m Ar^3$ であり、 m が 1 である場合、 Ar^3 はオルトジメチルアミノフェニルでないとする；

各 Z は独立して、O または NR^3 から選択される；

各 m は 1、または 2 である；

各 n は 2 または 3 である；

各 p は 0 または 1 である；

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)_2 OR^5$ 、 $NR^5 R^6$ 、シクロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5 R^6$ 、 $OC(O)NR^5 R^6$ 、 $NR^5 C(O)NR^5 R^6$ 、 $C(NR^6)NR^5 R^6$ 、 $NR^5 C(NR^6)NR^5 R^6$ 、 $S(O)_2 NR^5 R^6$ 、 R^7 、 $C(O)R^7$ 、 $NR^5 C(O)R^7$ 、 $S(O)R^7$ 、または $S(O)_2 R^7$ から選択される；

各 R^5 は独立して、水素、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_p Ar^4$ 、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、 $(CH_2)_p Ar^4$ または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は、独立して、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または 1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、そのそれぞれは所望により H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は、 Ar^2 、または所望により Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールから選択され、そのそれぞれは所望により H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

q は 2 である；

各 R^2 は独立して、 $(CH_2)_m CO_2 R^3$ 、 $(CH_2)_m CO Ar^3$ 、 $(CH_2)_m CONR^3 R^4$ 、 $(CH_2)_m Ar^3$ 、 $(CH_2)_3 Ar^3$ 、 $(CH_2)_n NR^3 R^4$ また

10

20

30

40

50

は $(\text{CH}_2)_n \text{OR}^4$ から選択される；

各 R^3 は独立して、H、または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、または $(\text{CH}_2)_p \text{Ar}^3$ から選択される；

各 Ar^3 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 Z は独立して、O または NR^3 から選択される；

各 m は 1、または 2 である；

各 n は 2 または 3 である；

各 p は 0 または 1 である；

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 OR^5 、 SR^5 、 $\text{S}(\text{O})_2 \text{OR}^5$ 、 $\text{NR}^5 \text{R}^6$ 、シクロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_2$ パーフフルオロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $\text{C}(\text{O}) \text{OR}^5$ 、 $\text{C}(\text{O}) \text{NR}^5 \text{R}^6$ 、 $\text{OC}(\text{O}) \text{NR}^5 \text{R}^6$ 、 $\text{NR}^5 \text{C}(\text{O}) \text{NR}^5 \text{R}^6$ 、 $\text{C}(\text{NR}^6) \text{NR}^5 \text{R}^6$ 、 $\text{NR}^5 \text{C}(\text{NR}^6) \text{NR}^5 \text{R}^6$ 、 $\text{S}(\text{O})_2 \text{NR}^5 \text{R}^6$ 、 R^7 、 $\text{C}(\text{O}) \text{R}^7$ 、 $\text{NR}^5 \text{C}(\text{O}) \text{R}^7$ 、 $\text{S}(\text{O}) \text{R}^7$ 、または $\text{S}(\text{O})_2 \text{R}^7$ から選択される；

各 R^5 は、独立して、水素、または所望により、ハロゲン、OH、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノ、または $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^6 は独立して、水素、 $(\text{CH}_2)_p \text{Ar}^4$ 、または所望により、ハロゲン、OH、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノ、または $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、 $(\text{CH}_2)_p \text{Ar}^4$ 、または所望により、ハロゲン、OH、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノ、または $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は独立して、 $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、OH、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノ、または 1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、

R^2 は、 $(\text{CH}_2)_m \text{CO}_2 \text{R}^3$ 、 $(\text{CH}_2)_m \text{COAr}^3$ 、または $(\text{CH}_2)_m \text{CONR}^3 \text{R}^4$ であり、m は 2 である；

ここにおいて、

R^1 は、 Ar^2 、または Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルであり、

R^2 は $(\text{CH}_2)_m \text{Ar}^3$ であり、m は 1 である。ただし、 R^1 は、フリルメチルまたはテトラヒドロフリルメチルでないとする；

ここにおいて、

Ar^1 および R^1 はそれぞれは所望により置換されていてもよいアリールであり、 R^2 は独立して、 $(\text{CH}_2)_m \text{Ar}^3$ 、 $(\text{CH}_2)_3 \text{Ar}^3$ 、 $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^3 \text{R}^4$ 、または $(\text{CH}_2)_n \text{OR}^4$ から選択される；

ここにおいて、

各 R^2 は独立して、 $(\text{CH}_2)_m \text{Ar}^3$ から選択され、各 Ar^3 は、所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよいヘテロアリールである；

ここにおいて、

Ar^3 は、所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい、炭素原子および 1、2、または 3 個の、N、O および S から選択されるヘテロ原子を有する 5 員環を有するヘテロアリールである；

ここにおいて、

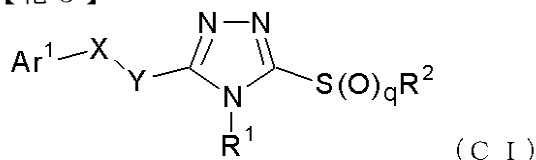
Ar^3 は、ピロリジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、チオイミダゾリル、ベンズイミダゾリル、またはベンズチオイミダゾリルであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、式 B I の化合物は、本明細書における任意の表において示される化合物またはその医薬的塩である。

【0011】

一態様は、対象者において疾患または病徴を治療する方法であって、対象者に有効量の式 C I の化合物：

【化 3】



10

(式中、

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

X は、 NR^3 、 $C(R^3)_2$ 、S、結合または O であるか、または Y と一緒になって $-CH=CH-$ を形成する；

20

Y は、 $C=O$ 、結合、または低級アルキルであるか、または X と一緒になって、 $-CH=CH-$ を形成する；

R^1 は、 Ar^2 、アルケニル、または所望により Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

q は 0、1 または 2 である；

各 R^2 は独立して、 $(CH_2)_m CO_2 R^3$ 、 $(CH_2)_m CO Ar^3$ 、 $(CH_2)_m CONR^3 R^4$ 、 $(CH_2)_m Ar^3$ 、 $(CH_2)_3 Ar^3$ 、 $(CH_2)_n NR^3 R^4$ 、 $(CH_2)_n OR^4$ ； $(CH_2)_m CN$ ；アルキル；アルキニル、 $(CR^3 R^3)_m CONR^3 R^4$ 、 Ar^4 、 $(CR^3 R^3)_m N(R^3)C(O)Ar^3$ 、または $(CH_2)_m C(NO)NH_2$ である；

30

各 R^3 は独立して、H、または低級アルキルである；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、アルコキシ、 $(CH_2)_n NR^5 R^6$ 、または $(CH_2)_p Ar^3$ である；

m は 1、または 2 である；

n は 2、または 3 である；

p は 0、または 1 である；

各 Ar^3 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

40

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)_2 OR^5$ 、 $NR^5 R^6$ 、シクロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5 R^6$ 、 $OC(O)NR^5 R^6$ 、 $NR^5 C(O)NR^5 R^6$ 、 $C(NR^6)NR^5 R^6$ 、 $NR^5 C(NR^6)NR^5 R^6$ 、 $S(O)_2 NR^5 R^6$ 、 R^7 、 $C(O)R^7$ 、 $NR^5 C(O)R^7$ 、 $S(O)R^7$ 、または $S(O)_2 R^7$ である；

各 R^5 は独立して、水素、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルである；

50

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_p Ar^4$ 、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 R^7 は独立して、 $(CH_2)_p Ar^4$ 、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 Ar^4 は独立して、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、ヘテロサイクリル、アリール、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または 1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1~3 個の置換基で置換されていてもよい）またはその医薬的塩を投与することを含む方法である。

10

【0012】

他の態様において、方法は、本明細書における任意の式を有するもの（その任意の組み合わせを包含する）であり、

ここにおいて、

Ar^1 は、アリール、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

X は、 NR^3 である；

20

Y は低級アルキルである；

R^1 は、所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよいアリールである；

各 R^2 は、独立して、 $(CH_2)_m CO_2 R^3$ 、 $(CH_2)_m CO Ar^3$ 、 $(CH_2)_m CONR^3 R^4$ 、 $(CH_2)_m Ar^3$ 、 $(CH_2)_3 Ar^3$ 、または $(CH_2)_n NR^3 R^4$ である。

ここにおいて、

Ar^1 はアリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

X は結合である；

Y は結合である；

30

R^1 は、所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよいアリールである；

各 R^2 は、独立して、 $(CH_2)_m CO_2 R^3$ 、 $(CH_2)_m CO Ar^3$ 、 $(CH_2)_m CONR^3 R^4$ 、 $(CH_2)_m Ar^3$ 、 $(CH_2)_3 Ar^3$ 、 $(CH_2)_n NR^3 R^4$ から選択される；

ここにおいて、各 R^2 は独立して、 $(CH_2)_m Ar^3$ から選択される；

ここにおいて、

各 R^2 は独立して、 $(CH_2)_m Ar^3$ から選択される；

各 Ar^3 は、所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよいヘテロアリールである；

ここにおいて、 Ar^3 は、所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい、炭素原子および 1、2、または 3 個の、N、O および S から選択されるヘテロ原子を有する 5 員環を含むヘテロアリールである；

40

ここにおいて、 Ar^3 は、ピロリジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾキサゾリル、またはベンズチアゾリルであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、式 C I の化合物は、表 C 1 において記載されている化合物、またはその医薬的塩である。

【0013】

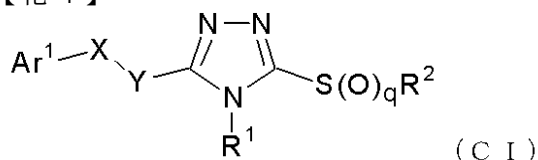
もう一つ別の態様は、カルシウムチャンネル活性を調節する方法であって、カルシウムチャンネルを本明細書における任意の式の化合物と接触させることを含む方法である。

もう一つ別の態様は、前記式 C I の化合物、またはその医薬的塩である。

50

もう一つ別の態様は、式 C I の化合物またはその医薬的塩である：

【化 4】



(式中、

$A r^1$ は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよく、それぞれは炭素原子により X と結合している； 10

X は $C H_2$ である；

Y は結合である；

R^1 は、 $A r^2$ 、アルケニル、または所望により $A r^2$ で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 $A r^2$ は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

q は 0、1 または 2 である；

各 R^2 は独立して、 $(C H_2)_m C O_2 R^3$ 、 $(C H_2)_m C O A r^3$ 、または $(C H_2)_m C O N R^3 R^4$ から選択される； 20

各 R^3 は独立して、H、または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、アルコキシ、 $(C H_2)_n N R^5 R^6$ 、または $(C H_2)_p A r^3$ から選択される；

m は 2 である；

n は 2、または 3 である；

p は 0、または 1 である；

各 $A r^3$ は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

$A r^1$ 、 $A r^2$ および $A r^3$ の各置換基は、独立して、ハロゲン、CN、 $N O_2$ 、 $O R^6$ 、 $S R^6$ 、 $S (O)_2 O R^5$ 、 $N R^5 R^6$ 、シクロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C (O) O R^5$ 、 $C (O) N R^5 R^6$ 、 $O C (O) N R^5 R^6$ 、 $N R^5 C (O) N R^5 R^6$ 、 $C (N R^6) N R^5 R^6$ 、 $N R^5 C (N R^6) N R^5 R^6$ 、 $S (O)_2 N R^5 R^6$ 、 R^7 、 $C (O) R^7$ 、 $N R^5 C (O) R^7$ 、 $S (O) R^7$ 、または $S (O)_2 R^7$ である； 30

各 R^5 は独立して、水素、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $N H_2$ 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 R^6 は独立して、水素、 $(C H_2)_p A r^4$ 、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $N H_2$ 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルである； 40

各 R^7 は独立して、 $(C H_2)_p A r^4$ 、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $N H_2$ 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 $A r^4$ は独立して、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、ヘテロサイクリル、アリール、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $N H_2$ 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または 1, 2-メ 50

チレンジオキシから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい)。

【0014】

他の態様において、化合物は本明細書における任意の式（その任意の組み合わせを包含する）のものであり、

ここにおいて、

$A r^1$ は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよく、それぞれは炭素原子により Z に結合している；

X は結合である；

Y は結合である；

10

R^1 は、 $A r^2$ である；

各 $A r^2$ は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は 4-ピリジルメチルである；

ここにおいて、

$A r^1$ は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよく、それぞれは炭素原子により X と結合しているが、 $A r^1$ は 4-ピリジルでない；

X は結合である；

Y は結合である；

20

R^1 は、 $A r^2$ である；

各 $A r^2$ は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は 3-ピリジルメチルである；

ここにおいて、

$A r^1$ は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよく、それぞれは炭素原子により X に結合している；

X は結合である；

Y は結合である；

30

R^1 は、 $A r^2$ である；

各 $A r^2$ は、独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は、2-ピリジルメチルである；

ここにおいて、

$A r^1$ は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

X は結合である；

Y は結合である；

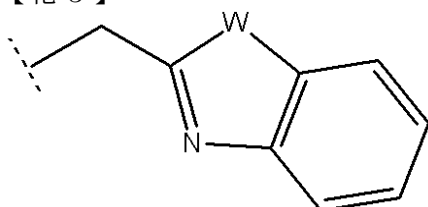
40

R^1 は、 $A r^2$ である；

各 $A r^2$ は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は：

【化 5】



である；

ここにおいて、Wは、 NR^3 、S、またはOである。

ここにおいて、

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により1以上の置換基で置換されていてもよい；

Xは結合である；

Yは結合である；

R^1 は、 Ar^2 である；

各 Ar^2 は、独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により1以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は $(\text{CH}_2)_m \text{Ar}^3$ である；

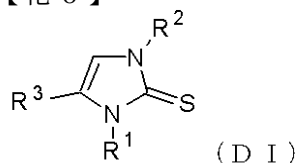
各 Ar^3 は、 NH_2 、 $\text{S}(\text{O})_2 \text{OR}^3$ 、 COOH 、または $\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ で置換されたアリールである。

10

【0015】

一態様は、式D-(I)の化合物またはその医薬的塩である；

【化6】



20

(式中、

R^3 は、 Ar^1 または $\text{Ar}^1 - \text{X} - \text{Y}$ であり、ここにおいて、

各 Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により1以上の置換基で置換されていてもよい；

Xは、 NR^4 、 $\text{C}(\text{R}^4)_2$ 、またはOである；

Yは、 $\text{C}=\text{O}$ 、または低級アルキルである；

R^1 は、 Ar^2 、または所望により Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により1以上の置換基で置換されていてもよい；

30

各 R^2 は独立して、 $(\text{CH}_2)_m \text{C}(\text{O})\text{OR}^4$ 、 $(\text{CH}_2)_m \text{C}(\text{O})\text{Ar}^3$ 、 $(\text{CH}_2)_m \text{C}(\text{O})\text{NR}^4 \text{R}^5$ 、 $(\text{CH}_2)_n \text{NR}^4 \text{R}^5$ 、 $(\text{CH}_2)_3 \text{Ar}^3$ 、または $(\text{CH}_2)_m \text{Ar}^3$ から選択される；

各 R^4 は独立して、H、または低級アルキルから選択される；

各 R^5 は独立して、H、低級アルキル、または $(\text{CH}_2)_p \text{Ar}^3$ から選択される；

mは1、または2である；

nは2または3である；

pは0または1である；

各 Ar^3 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により1以上の置換基で置換されていてもよい；

40

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 OR^6 、 SR^6 、 $\text{S}(\text{O})_2 \text{OR}^6$ 、 $\text{NR}^6 \text{R}^7$ 、シクロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_2$ パーフフルオロアルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}^6$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^6 \text{R}^7$ 、 $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^6 \text{R}^7$ 、 $\text{NR}^6 \text{C}(\text{O})\text{NR}^6 \text{R}^7$ 、 $\text{C}(\text{NR}^6) \text{NR}^6 \text{R}^7$ 、 $\text{NR}^6 \text{C}(\text{NR}^7) \text{NR}^6 \text{R}^7$ 、 $\text{S}(\text{O})_2 \text{NR}^6 \text{R}^7$ 、 R^8 、 $\text{C}(\text{O}) \text{R}^8$ 、 $\text{NR}^6 \text{C}(\text{O}) \text{R}^8$ 、 $\text{S}(\text{O}) \text{R}^8$ 、または $\text{S}(\text{O})_2 \text{R}^8$ から選択される；

各 R^6 は独立して、水素、または所望により、ハロゲン、OH、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルアミノ、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$ ジアルキルアミノ、または $\text{C}_3 - \text{C}_6$ シクロアルキルから独立して選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキ

50

ルから選択される；

各 R^7 は独立して、水素、 $(CH_2)_q Ar^4$ 、または、所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^8 は独立して、 $(CH_2)_q Ar^4$ 、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は独立して、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい；

q は 0、または 1 である）。

【0016】

もう一つ別の態様は、本明細書の任意の式の化合物（その任意の組み合わせを包含する）であり、

ここにおいて、

R^3 は Ar^1 であり、 R^1 は Ar^2 である；

ここにおいて、

R^3 は独立して、アリール、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は独立して、アリール、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、 R^2 は、 $(CH_2)_m C(O)OR^4$ 、 $(CH_2)_m C(O)Ar^3$ または $(CH_2)_m C(O)NR^4R^5$ である；

ここにおいて、 R^2 は、 $(CH_2)_m Ar^3$ であり、 Ar^3 は、アリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、 R^2 は、 $(CH_2)_m C(O)NR^4R^5$ であり、 R^5 は独立して、 $(CH_2)_p Ar^3$ であり、ここにおいて、 Ar^3 はアリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、 R^2 は、 $(CH_2)_n NR^4R^5$ または $(CH_2)_m Ar^3$ である；

ここにおいて、 m は 2 であり、 Ar^3 は、所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい、炭素原子および 1、2、または 3 個の、N、O および S から選択されるヘテロ原子を有する 5 員環を含むヘテロアリールである；

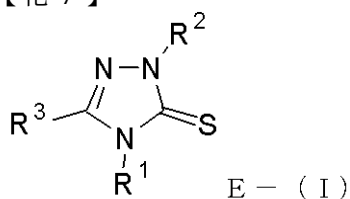
ここにおいて、 Ar^3 は、ピロリジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾキサゾリル、またはベンズチアゾリルであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、式 D-I の化合物は、表 D-(1～6) の任意の化合物である。

【0017】

一態様は、式 E-I の化合物、またはその医薬的塩である；

【化7】



（式中、

10

20

30

40

50

R^3 は、アルキル、アルコシアルキル、 $A r^1$ 、または $A r^1 - X - Y$ であり、ここにおいて、

各 $A r^1$ は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

X は、 $N R^4$ 、 $C(R^4)_2$ 、または O である；

Y は、 $C=O$ または低級アルキルである；

R^1 は、 H 、アルケニル、 $A r^2$ 、または所望により $A r^2$ で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 $A r^2$ は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は独立して、 H 、 $(CH_2)_m C(O)OR^4$ 、 $(CH_2)_m C(O)Ar^3$ 、 $(CH_2)_m C(O)NR^4 R^5$ 、 $(CH_2)_m C(O)N(OR^4)R^5$ 、 $(CH_2)_m CH_2 OR^4$ 、 Ar^3 、 $(CH_2)_n Ar^3$ 、 $(CH_2)_n NR^4 R^5$ 、または $(CH_2)_m Ar^3$ から選択される；

各 R^4 は独立して、 H 、または低級アルキルから選択される；

m は 1、または 2 である；

n は 2 または 3 である；

p は 0 または 1 である；

各 $A r^3$ は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

$A r^1$ 、 $A r^2$ および $A r^3$ の各置換基は、独立して、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 OR^6 、 SR^6 、 $S(O)_2 OR^6$ 、 $NR^6 R^7$ 、シクロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O)OR^6$ 、 $C(O)NR^6 R^7$ 、 $OC(O)NR^6 R^7$ 、 $NR^6 C(O)NR^6 R^7$ 、 $C(NR^6)NR^6 R^7$ 、 $NR^6 C(NR^7)NR^6 R^7$ 、 $S(O)_2 NR^6 R^7$ 、 R^8 、 $C(O)R^8$ 、 $NR^6 C(O)R^8$ 、 $S(O)R^8$ 、または $S(O)_2 R^8$ から選択される；

各 R^6 は独立して、水素、または所望により、ハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、水素、 $(CH_2)_q Ar^4$ 、または、所望により、ハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^8 は独立して、 $(CH_2)_q Ar^4$ または所望により、ハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 $A r^4$ は独立して、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

q は 0 または 1 である）。

【0018】

もう一つ別の態様は、本明細書における任意の式の化合物（その組み合わせを包含する）である；

ここにおいて、

R^3 は $A r^1$ であり、 R^1 は $A r^2$ である；

ここにおいて、

R^3 は独立して、アリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の

10

20

30

40

50

置換基で置換されていてもよい；

R^1 は独立して、アリール、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、 R^2 は、 $(CH_2)_m C(O)OR^4$ 、 $(CH_2)_m C(O)Ar^3$ または $(CH_2)_m C(O)NR^4R^5$ である；

ここにおいて、 R^2 は $(CH_2)_m Ar^3$ であり、 Ar^3 はアリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、 R^2 は $(CH_2)_m C(O)NR^4R^5$ であり、 R^5 は独立して $(CH_2)_p Ar^3$ であり、ここにおいて、 Ar^3 はアリールまたはヘテロアリールであって、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

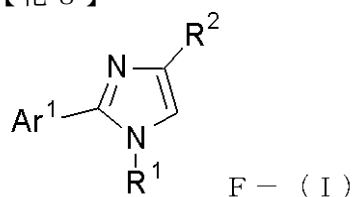
ここにおいて、 R^2 は、 $(CH_2)_n NR^4R^5$ または $(CH_2)_m Ar^3$ であるか；あるいは

式 E-I の化合物は本明細書の表における任意のものである。

【0019】

一態様は、対象者において疾患または病徴を治療する方法であって、対象者に有効量の式 (F I)：

【化 8】



の化合物またはその医薬的塩を投与することを含む方法である

(式中、

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、それぞれは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は、 Ar^2 、または所望により Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、そのそれぞれは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は独立して、 CO_2R^3 、 $COAr^3$ 、 $CONR^3R^4$ 、 Ar^3 、 $CH_2NR^3R^4$ から選択される；

各 R^3 は独立して、H、または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 $C(O)R^7$ 、 $S(O)_2R^7$ 、または $(CH_2)_p Ar^3$ から選択される；

各 Ar^3 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 p は独立して 0 または 1 である；

Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)_2OR^5$ 、 NR^5R^6 、シクロアルキル、 C_1-C_2 パーフフルオロアルキル、 C_1-C_2 パ

10

20

30

40

50

ーフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $OC(O)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(O)NR^5R^6$ 、 $C(NR^5)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(NR^6)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 R^7 、 $C(O)R^7$ 、 $NR^6C(O)R^7$ 、 $S(O)R^7$ 、または $S(O)_2R^7$ から選択される；

各 R^5 は独立して、水素、または、所望により、ハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノ、または C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_qAr^4$ 、または、所望により、ハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノ、または C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、 $(CH_2)_qAr^4$ または、所望により、ハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノ、または C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は独立して、 C_3-C_6 シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノ、または1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい；

各 q は独立して0または1である）。

【0020】

他の態様において、方法は本明細書における任意の式を有するもの（その任意の組み合わせを包含する）であり；

ここにおいて、

各 R^2 は独立して、 $CONR^3R^4$ 、 Ar^3 、 $CH_2NR^3R^4$ である；

ここにおいて、

Ar^1 は、アリールまたはヘテロアリールであり、そのそれぞれは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は Ar^2 である；

Ar^2 は独立して、アリールまたはヘテロアリールであり、そのそれぞれは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、

各 R^2 は独立して Ar^3 であり；

各 Ar^3 は独立して、アリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは所望により1以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、

各 Ar^3 は独立してヘテロアリールであり、それぞれは所望により1以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、

各 R^2 は独立して $CONR^3R^4$ である；

各 R^4 は $(CH_2)_pAr^3$ である；

ここにおいて、

各 Ar^3 は独立して、アリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは所望により1以

10

20

30

40

50

上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、

Ar^3 は独立して、所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい窒素含有ヘテロアリールである；

ここにおいて、

各 R^2 は独立して $CH_2NR^3R^4$ である；

各 R^4 は $(CH_2)_pAr^3$ である；

ここにおいて、

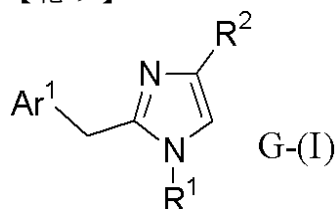
Ar^3 は独立して、所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい窒素含有ヘテロアリールである。

10

【0021】

一態様は、式 G-(I) の化合物またはその医薬的塩である；

【化9】



式中、

20

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールであり、そのそれぞれは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は、 Ar^2 、または所望により Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールから選択され、そのそれぞれは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

30

各 R^2 は独立して、 CO_2R^3 、 $COAr^3$ 、 $CONR^3R^4$ 、 $(CH_2)_mAr^3$ 、 $(CH_2)_nNR^3R^4$ または CH_2OR^4 から選択される；

各 R^3 は独立して、H、または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 $C(O)R^7$ 、 $S(O)_2R^7$ 、または $(CH_2)_pAr^3$ から選択される；

各 Ar^3 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

40

各 m は独立して 0 または 1 である；

各 n は独立して 1 または 2 である；

各 p は独立して 0 または 1 である；

Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)_2OR^5$ 、 NR^5R^6 、シクロアルキル、 C_1-C_2 パーフルオロアルキル、 C_1-C_2 パーフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $OC(O)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(O)NR^5R^6$ 、 $C(NR^5)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(NR^6)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 R^7 、 $C(O)R^7$ 、 $NR^6C(O)R^7$ 、 $S(O)R^7$ 、または $S(O)_2R^7$ から選択される；

50

各 R^5 は独立して、水素、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_q Ar^4$ 、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、または $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、 $(CH_2)_q Ar^4$ または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は独立して、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは 1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい；

各 q は独立して 0 または 1 である。

【0022】

他の態様において、化合物は本明細書における任意の式のもの（任意のその組み合わせを包含する）である；

ここにおいて、

Ar^1 は、アリールまたはヘテロアリールであり、そのそれぞれは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は Ar^2 である；

Ar^2 は独立して、アリールまたはヘテロアリールから選択され、そのそれぞれは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は独立して、 $COAr^3$ 、 $CONR^3R^4$ 、 $(CH_2)_m Ar^3$ 、または $(CH_2)_n NR^3R^4$ から選択される；

ここにおいて、

Ar^1 はアリールであり、これは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

Ar^2 は独立してアリールであり、これは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は独立して、 $(CH_2)_m Ar^3$ 、または $(CH_2)_n NR^3R^4$ から選択される；

ここにおいて、

各 Ar^3 は独立して、アリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

10

20

30

40

50

ここにおいて、

各 R^4 は $(CH_2)_p Ar^3$ である；

各 Ar^3 は独立して、アリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、

各 R^2 は独立して選択された $(CH_2)_n NR^3 R^4$ である；

各 R^4 は $(CH_2)_p Ar^3$ である；

ここにおいて、

R^1 はパラクロロフェニルである；

ここにおいて、

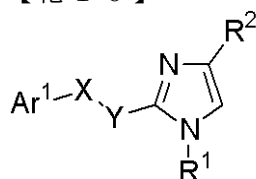
Ar^1 はパラクロロフェニルである；

ここにおいて、式 G-I の化合物は、本明細書における任意の表に示される化合物、またはその医薬的塩である。

【0023】

一態様は、式 H-I の化合物、またはその医薬的塩である；

【化10】



H-(I)

式中、

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、そのそれぞれは、所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

X は、 NR^3 、 $C(R^3)_2$ 、または O である；

Y は、 $C=O$ 、または低級アルキルである；

R^1 は、 Ar^2 または所望により Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

Ar^2 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、そのそれぞれは所望により H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジ-アルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は独立して、 $CO_2 R^3$ 、 $CO Ar^3$ 、 $CONR^3 R^4$ 、 $(CH_2)_m Ar^3$ 、 $CH_2 NR^3 R^4$ または $CH_2 OR^4$ から選択される；

各 R^3 は独立して、H、または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5 R^6$ 、 $S(O)_2 NR^5 R^6$ 、 $C(O)R^7$ 、 $S(O)_2 R^7$ または $(CH_2)_p Ar^3$ から選択される；

各 Ar^3 は独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 m は独立して 0 または 1 である；

各 p は独立して 0 または 1 である；

Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)_2 OR^5$ 、 $NR^5 R^6$ 、シクロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5 R$

10

20

30

40

50

R^6 、 $OC(O)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(O)NR^5R^6$ 、 $C(NR^5)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(NR^6)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 R^7 、 $C(O)R^7$ 、 $NR^6C(O)R^7$ 、 $S(O)R^7$ 、または $S(O)_2R^7$ から選択される；

各 R^5 は独立して、水素、または所望により、ハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノまたは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_qAr^4$ 、または所望により、ハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノまたは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、 $(CH_2)_qAr^4$ または所望により、ハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノまたは C_3-C_6 シクロアルキルから独立して選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は独立して、 C_3-C_6 シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、OH、 C_1-C_4 アルコキシ、 NH_2 、 C_1-C_4 アルキルアミノ、 C_1-C_4 ジアルキルアミノ、または1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい；

各 q は独立して0または1である。

【0024】

他の態様において、化合物は、本明細書の任意の式のもの（その任意の組み合わせを含む）である；

ここにおいて、

Ar^1 は、アリール、またはヘテロアリールであり、そのそれぞれは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

X は NR^3 である；

Y は $C=O$ または低級アルキルである；

R^1 は Ar^2 である；

Ar^2 は独立して、アリールまたはヘテロアリールであり、そのそれぞれは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は独立して、 $COAr^3$ 、 $CONR^3R^4$ 、 $(CH_2)_mAr^3$ 、または $CH_2NR^3R^4$ である；

Y は $C=O$ である；

Ar^2 は独立して、所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される1以上の置換基で置換されていてもよいアリールである；

ここにおいて、

Y は低級アルキルである；

R^1 は Ar^2 である；

Ar^2 は独立して、アリールまたはヘテロアリールであり、そのそれぞれは所望により、H、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、カルボキシレート、アルキル、ア

10

20

30

40

50

ルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロヘキシル、アルコキシ、モノおよびジアルキルアミノ、フェニル、カルボキサミド、ハロアルキル、ハロアルコキシ、およびアルカノイルからなる群から選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、

各 R^2 は独立して、 $CONR^3R^4$ または $CH_2NR^3R^4$ である；

ここにおいて、

各 R^2 は独立して $(CH_2)_mAr^3$ である；

ここにおいて、

Ar^3 は、所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよいヘテロアリールである；

ここにおいて、

各 R^4 は独立して $(CH_2)_pAr^3$ である；

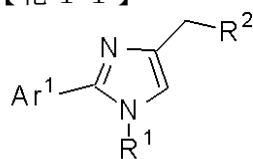
ここにおいて、式 H-I の化合物は、本明細書における任意の表に示される化合物、またはその医薬的塩である。

10

【0025】

一態様は、式 J-I の化合物またはその医薬的塩である；

【化 11】



J - (I)

20

(式中、

Ar^1 は、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は、 Ar^2 または所望により Ar^2 で置換されていてもよい低級アルキルである；

各 Ar^2 は、独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

各 R^2 は独立して、 $(CH_2)_mCO_2R^3$ 、 $(CH_2)_mCOAr^3$ 、 $(CH_2)_mCONR^3R^4$ 、 $(CH_2)_mAr^3$ ； $(CH_2)_nOR^3$ ； $(CH_2)_nAr^3$ または $(CH_2)_nNR^3R^4$ から選択される；

各 R^3 は独立して、H または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 $C(O)R^7$ 、 $S(O)_2R^7$ 、または $(CH_2)_pAr^3$ から選択されるか；または

各 R^3 および R^4 は、これらがどちらも結合している窒素原子と一緒にあって 4～7 員複素環を形成する（ここにおいて、各複素環における 1 つの炭素原子は、所望により NR^4 、O、または S であり、各複素環は所望により 1 以上の低級アルキル基で置換されていてもよい）；

各 Ar^3 は、独立して、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールであり、それぞれは所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

40

各 m は独立して 0 または 1 である；

各 n は独立して 1 または 2 である；

各 p は独立して 0 または 1 である；

Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 OR^5 、 SR^5 、 $S(O)_2OR^5$ 、 NR^5R^6 、シクロアルキル、 C_1-C_2 パーフフルオロアルキル、 C_1-C_2 パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシ、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5R^6$ 、 $OC(O)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(O)NR^5R^6$ 、 $C(NR^5)NR^5R^6$ 、 $NR^5C(NR^6)NR^5R^6$ 、 $S(O)_2NR^5R^6$ 、 R^7 、 $C(O)R^7$ 、 $NR^6C(O)R^7$ 、 $S(O)R^7$ 、または $S(O)_2R^7$ から選択される；

50

各 R^5 は独立して、水素、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_p Ar^4$ 、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^7 は独立して、 $(CH_2)_p Ar^4$ または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは $C_3 - C_6$ シクロアルキルから独立して選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 Ar^4 は独立して、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノまたは 1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい。

【0026】

他の態様は、本明細書における任意の式の化合物（その任意の組み合わせを包含する）である；

ここにおいて、各 R^2 は独立して、 $(CH_2)_m CO_2 R^3$ 、 $(CH_2)_m COAr^3$ 、 $(CH_2)_m CONR^3 R^4$ 、 $(CH_2)_n Ar^3$ または $(CH_2)_n NR^3 R^4$ である；

ここにおいて、

R^1 は、 Ar^2 で置換された $C_1 - C_2$ アルキルである；

Ar^2 は、所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、

R^1 は Ar^2 である；

Ar^2 は所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、

R^2 は、 $(CH_2)_m C(O)OR^3$ 、 $(CH_2)_m C(O)Ar^3$ 、または $(CH_2)_m C(O)NR^3 R^4$ であり、各 m は独立して 0 または 1 である；

各 Ar^3 は所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、

R^2 は $(CH_2)_n NR^3 R^4$ であり、 n は 1 である；

ここにおいて、

R^2 は $(CH_2)_n NR^3 R^4$ であり、 n は 2 である；

ここにおいて、

R^2 は $(CH_2)_m Ar^3$ であり、 m は 0 である；

Ar^3 は所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、

R^2 は $(CH_2)_m Ar^3$ であり、 m は 1 である；

Ar^3 は所望により 1 以上の置換基で置換されていてもよい；

ここにおいて、

各 Ar^1 、 Ar^2 、 Ar^3 および Ar^4 は独立して、シクロアルキル、フェニル、ナフチル、アセナフチル、インデニル、アズレニル、フルオレニル、アントラセニル、フリル、チエニル、ピリジル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラキソリル、ピラゾリニル、ピラゾリジニル、イソキサゾリル、イソトリアゾリル、オキサジアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、トリアジニル、トリチアニル、インドリジニル、インドリル、イソインドリル、3H-インドリル、インドリニル、ベンゾ- $[b]$ フラニル、ベンゾ- $[b]$ チオフェニル、1H-イン

10

20

30

40

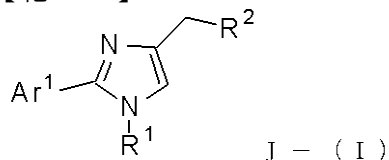
50

ダゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンズチアゾリル、プリニル、4H-キノリジニル、キノリニル、テトラヒドロイソキノリニル、イソキノリニル、テトラヒドロキノリン、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ペリジニル、カルバゾリル、アクリジニル、フェナジニル、フェノチアジニル、またはフェノキサジニルから選択され、それぞれは所望により1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0027】

ここにおいて、化合物は、式J-(I)：

【化12】



10

(式中、

Ar^1 は、アリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは所望により1～3個の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は、 Ar^2 である；

各 Ar^2 は、独立して、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により1～3個の置換基で置換されていてもよい；

20

各 R^2 は $(CH_2)_n NR^3 R^4$ であり、nは1である。ここにおいて、

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5 R^6$ 、 $S(O)_2 NR^5 R^6$ 、 $C(O)R^7$ 、 $S(O)_2 R^7$ 、または $(CH_2)_p Ar^3$ から選択されるか；または

各 R^3 および R^4 は、これらがどちらも結合している窒素原子と一緒にあって4～7員複素環を形成する（ここにおいて、各複素環における1つの炭素原子は所望により NR^4 、O、またはSであり、各複素環は所望により1または2個の低級アルキル基で置換されていてもよい）；

各 p は独立して0または1である；

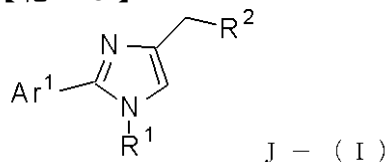
各 Ar^3 は、独立して、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により1～3個の置換基で置換されていてもよい）のものである；

30

【0028】

ここにおいて、化合物は式J-(I)：

【化13】



40

(式中、

Ar^1 はアリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは所望により1～3個の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は Ar^2 である；

各 Ar^2 は独立して、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により1～3個の置換基で置換されていてもよい；

R^2 は $(CH_2)_n NR^3 R^4$ であり、nは2であって、ここにおいて、

各 R^4 は独立して、H、低級アルキル、 $C(O)OR^5$ 、 $C(O)NR^5 R^6$ 、 $S(O)_2 NR^5 R^6$ 、 $C(O)R^7$ 、 $S(O)_2 R^7$ または $(CH_2)_p Ar^3$ から選択されるか；または

50

各 R^3 および R^4 は、これらが両方とも結合している窒素原子と一緒にあって、4～7員複素環を形成し、ここにおいて、

各複素環中の1つの炭素原子は、所望により NR^4 、O、またはSであり、各複素環は、所望により1または2個の低級アルキル基で置換されていてもよい；

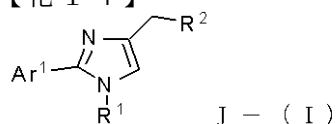
各 p は独立して0または1である；

各 Ar^3 は独立して、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により1～3個の置換基で置換されていてもよい）のものである；

【0029】

ここにおいて、化合物は、式 J - (I)：

【化14】



10

(式中、

Ar^1 は、アリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは所望により1～3個の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は Ar^2 である；

各 Ar^2 は独立して、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により1～3個の置換基で置換されていてもよい；

20

R^2 は $(CH_2)_m Ar^3$ であり、mは0である；

各 Ar^3 は独立して、アリール、またはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により1～3個の置換基で置換されていてもよい；

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、 OR^5 、 $NR^5 R^6$ 、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシから選択される；

各 R^5 は独立して、水素、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノから選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_p Ar^4$ 、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノから選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

30

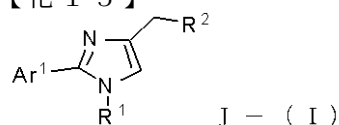
各 p は独立して0または1である；

各 Ar^4 は独立してアリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシから選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を有するものである；

【0030】

ここにおいて、化合物は式 J - (I)：

【化15】



40

(式中、

Ar^1 はアリールまたはヘテロアリールであり、それぞれは所望により1～3個の置換基で置換されていてもよい；

R^1 は Ar^2 である；

各 Ar^2 は独立して、ヘテロサイクリルまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは

50

所望により 1～3 個の置換基で置換されていてもよい；

R^2 は $(CH_2)_m Ar^3$ であり、 m は 1 である；

各 Ar^3 は独立して、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により 1～3 個の置換基で置換されていてもよい；

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 の各置換基は、独立して、ハロゲン、 OR^5 、 $NR^5 R^6$ 、 $C_1 - C_2$ パーフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシから選択される；

各 R^5 は独立して、水素、または所望により、ハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノから選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_p Ar^4$ 、または所望により、ハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノから選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 p は独立して 0 または 1 である；

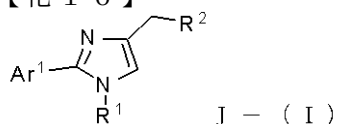
各 Ar^4 は独立して、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 - C_2$ パーフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい)

を有するものである；

【0031】

ここにおいて、化合物は式 J - (I)：

【化 16】



(式中、

Ar^1 は、1～3 個の置換基で置換されていてもよいフェニルである；

R^1 は、1～3 個の置換基で置換されていてもよい Ar^2 および Ar^2 フェニルである；

R^2 は $(CH_2)_n NR^3 R^4$ であり、 n は 1 である；

各 R^3 は独立して H または低級アルキルから選択される；

各 R^4 は $(CH_2)_p Ar^3$ である；

各 p は独立して 0 または 1 である；

各 Ar^3 は独立して、アリール、またはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により 1～3 個の置換基で置換されていてもよい；

Ar^1 、 Ar^2 および Ar^3 の各置換基は独立して、ハロゲン、 OR^5 、 $NR^5 R^6$ 、 $C_1 - C_2$ パーフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシから選択される；

各 R^5 は独立して、水素、または所望により、ハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノから選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_p Ar^4$ 、または所望により、ハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノから選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

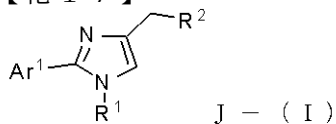
各 Ar^4 は独立して、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、 OH 、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 - C_2$ パーフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい)

を有するものである；

【0032】

ここにおいて、化合物は式 J - (I)：

【化17】



(式中、

Ar¹ は、1～3個の置換基で置換されたフェニルである；

10

R¹ は、1～3個の置換基で置換された Ar² および Ar² フェニルである；

R² は、(CH₂)_nNR³R⁴ であり、nは1である；

各 R³ および R⁴ は、これらが両方とも結合している窒素原子と一緒にあって、4～7員複素環を形成し、ここにおいて、

各複素環における一つの炭素原子は、任意に、NR⁴、O、または S であり、各複素環は、所望により1または2個の低級アルキル基で置換されていてもよい；

Ar¹ および Ar² の各置換基は、独立して、ハロゲン、OR⁵、NR⁵R⁶、C₁-C₂ パーフフルオロアルキル、C₁-C₂ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシから選択される；

各 R⁵ は独立して、水素、または所望により1以上の、ハロゲン、OH、C₁-C₄ アルコキシ、NH₂、C₁-C₄ アルキルアミノ、C₁-C₄ ジアルキルアミノから選択される置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

20

各 R⁶ は独立して、水素、(CH₂)_pAr⁴、または所望によりハロゲン、OH、C₁-C₄ アルコキシ、NH₂、C₁-C₄ アルキルアミノ、C₁-C₄ ジアルキルアミノから選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 p は独立して、0または1である；

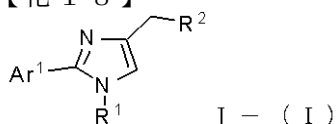
各 Ar⁴ は独立してアリール、またはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、OH、C₁-C₄ アルコキシ、NH₂、C₁-C₄ アルキルアミノ、C₁-C₄ ジアルキルアミノ、C₁-C₂ パーフフルオロアルキル、C₁-C₂ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される1以上の置換基で置換されていてもよい)を有するものである；

30

【0033】

ここにおいて、化合物は、式 J - (I)：

【化18】



(式中、

Ar¹ は、1～3個の置換基で置換されていてもよいフェニルである；

40

R¹ は、1～3個の置換基で置換されていてもよい Ar² および Ar² フェニルである；

R² は (CH₂)_mAr³ であり、mは0である；

各 Ar³ は、所望により1～3個の置換基で置換されていてもよいベンズイミダゾール-2-イルである；

Ar¹、Ar² および Ar³ の各置換基は、それぞれ独立して、ハロゲン、OR⁵、NR⁵R⁶、C₁-C₂ パーフフルオロアルキル、C₁-C₂ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシから選択される；

各 R⁵ は独立して、水素、または所望により、ハロゲン、OH、C₁-C₄ アルコキシ、NH₂、C₁-C₄ アルキルアミノ、C₁-C₄ ジアルキルアミノから選択される1以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

50

各 R^6 は独立して、水素、 $(CH_2)_p Ar^4$ 、または所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノから選択される 1 以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルから選択される；

各 p は独立して 0 または 1 である；

各 Ar^4 は独立して、アリールまたはヘテロアリールから選択され、それぞれは所望により、ハロゲン、OH、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 NH_2 、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、 $C_1 - C_4$ ジアルキルアミノ、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルキル、 $C_1 - C_2$ パーフフルオロアルコキシ、1, 2-メチレンジオキシから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されていてもよい) を有するものである；

ここにおいて、式 J-(I) の化合物は、本明細書における表 J-1 の任意のものである 10

【0034】

もう一つ別の態様は、対象者において Ca_v1 カルシウムチャンネルが介在する疾患または病徴を治療する方法であって、対象者に有効量の本明細書における任意の式の化合物またはその医薬的塩（またはその組成物）を投与することを含む方法である。

もう一つ別の態様は、本発明の任意の式の化合物、またはその医薬的塩、（またはその組成物）をカルシウムチャンネルと接触させることを含む、カルシウムチャンネル活性を調節（例えば、抑制、作用、拮抗）する方法である。

本発明の方法において、カルシウムチャンネルは、 Ca_v1 （例えば、 $Ca_v1.2$ または $Ca_v1.3$ ）である。 Ca_v1 カルシウムチャンネルが介在する疾患、または病徴は、神経系疾患、または病徴であるか、あるいは心血管疾患、または病徴である。 20

【0035】

もう一つ別の態様は、対象者において疾患、または病徴を治療する方法であって、対象者に有効量の本発明の任意の式の化合物、または医薬的塩、（またはその組成物）を投与することを含む方法である。疾患、または病徴は、狭心症、高血圧、鬱血性心不全、心筋虚血、心房性細動、真性糖尿病、尿失禁、過活動膀胱、肺病、認識機能、または神経系障害である；

ここにおいて、疾患、または病徴は、カルシウムチャンネル Ca_v1 により調節され；ここにおいて、疾患、または病徴は、カルシウムチャンネル $Ca_v1.2$ または $Ca_v1.3$ により調節され；ここにおいて、疾患、または病徴は、狭心症、高血圧、鬱血性心不全、心筋虚血、不整脈、糖尿病、尿失禁、卒中、疼痛、外傷性脳損傷、または神経障害である。 30

【0036】

もう一つ別の態様は、本発明の任意の式の化合物、またはその医薬的に許容される塩および医薬的に許容される担体を含む組成物である。組成物はさらに追加の治療薬を含むことができる。

もう一つ別の態様は、本発明の任意の式の化合物を調製する方法であって、本明細書において示される中間体を試薬と反応させて、本発明において定義するような任意の式の化合物を得ることを含む。

【0037】

もう一つ別の態様は、これを必要とする対象者においてカルシウムチャンネル活性を調節（例えば、阻害、作用、拮抗）する方法であって、対象者に有効量の本発明の任意の式の化合物、またはその医薬的に許容される塩、またはその組成物を投与することを含む方法である。

他の態様において、本発明は、本発明の任意の式の化合物、追加の治療薬、および医薬的に許容される担体を含む組成物に関する。追加の治療薬は、心血管疾患薬および／または神経系疾患薬であり得る。神経系疾患薬とは、末梢神経系 (PNS) 疾患薬および／または中枢神経系 (CNS) 疾患薬である。

【0038】

本発明のさらにもう一つ別の態様は、疾患、または病徴（狭心症、高血圧、鬱血性心不 50

全、心筋虚血、心房性細動、真性糖尿病、尿失禁、過活動膀胱、肺病、認識機能、または神経系障害を包含するが、これらに限定されない）を有する対象者（例えば、哺乳動物、ヒト、ウマ、イヌ、ネコなど）を治療する方法に関する。この方法は、対象者（かかる治療を必要とするとされる対象者を包含する）に有効量の本明細書に記載される化合物、または本明細書に記載される組成物を投与して、かかる効果を得ることを含む。かかる治療を必要とする対象者の特定は、対象者、または健康管理の専門家の判断により、主観的（例えば、鑑定）または客観的（試験、または診断法により測定可能）であり得る。

【0039】

本発明のさらに別の態様は、イオンチャンネルが介在する疾患、または病徴（狭心症、高血圧、鬱血性心不全、心筋虚血、心房性細動、真性糖尿病、尿失禁、過活動膀胱、肺病、認識機能、または神経系障害を包含するが、これらに限定されない）を有する対象者（例えば、哺乳動物、ヒト、ウマ、イヌ、ネコ）を治療する方法に関する。この方法は、対象者（かかる治療を必要とするとされる対象者を包含する）に有効量の本明細書において記載される化合物、または本明細書において記載される組成物を投与して、かかる効果を得ることを含む。かかる治療を必要とする対象者の特定は、対象者、または健康管理の専門家の判断により、主観的（例えば、鑑定）または客観的（試験、または診断法により測定可能）であり得る。

10

【0040】

本発明はさらに、本明細書に記載される化合物の調製法に関し、この方法は、スキームまたは実施例において示される任意の反応または試薬を包含する。別法として、方法は、本明細書に記載される中間体化合物の任意のものを取り、1以上の試薬と1以上の工程において反応させて、本明細書において記載される化合物を得ることを含む。

20

さらに本発明に含まれるのは、包装された製品である。包装された製品は、容器、容器中の前記化合物のうちの1つ、ならびに容器に添付され、イオンチャンネル調節に関連する障害を治療するための化合物の投与に関連する説明書（例えば、ラベル、または挿入物）を含む。

【0041】

他の具体例において、本明細書において示される化合物、組成物および方法は、本明細書における表の化合物の任意のもの、またはこれらを含む方法を示す。

本発明の1以上の具体例の詳細を以下の添付の図面および説明において記載する。本発明の他の特徴、目的、および利点は、説明および請求の範囲から明らかであろう。

30

【課題を解決するための手段】

【0042】

本明細書において用いられる場合、「ハロ」なる用語は、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素の任意のラジカルである。

「アルキル」なる用語は、表示された数の炭素原子を含有する直鎖または分枝鎖であってよい炭化水素鎖である。例えば、 $C_1 - C_5$ は、1～5個（両端を含む）の炭素原子をその中に有する基を示す。「低級アルキル」なる用語は、 $C_1 - C_6$ アルキル鎖である。

「アリールアルキル」なる用語は、アルキル水素原子がアリール基により置換されている部分である。

40

【0043】

「アルコキシ」なる用語は、 $-O-$ アルキルラジカルである。「アルキレン」なる用語は、二価アルキル（すなわち、 $-R-$ ）である。「アルキレンジオキソ」なる用語は、 $-O-R-$ （式中、 R はアルキレンを表す）の構造を有する二価種である。

本明細書において用いられる「シクロアルキル」なる用語は、3～12個、好ましくは3～8個の炭素、さらに好ましくは3～6個の炭素を有する飽和および部分不飽和環状炭化水素基を包含する。

【0044】

「アリール」なる用語は、6員単環または10～14員多環芳香族炭化水素環系であり、ここにおいて、各環の0、1、2、3、または4個の原子は置換基により置換されてい

50

てもよい。アリール基の例としては、フェニル、ナフチルなどが挙げられる。

「ヘテロサイクリル」なる用語は、単環ならば1～3個のヘテロ原子、二環ならば1～6個のヘテロ原子、三環ならば1～6個のヘテロ原子を有する、非芳香族5～8員単環、8～12員二環、または11～14員三環式環系を意味し、前記ヘテロ原子は、O、N、またはSから選択され（例えば、炭素原子および単環、二環、または三環ならばそれぞれ1～3、1～6、または1～9個の、N、O、またはSのヘテロ原子）、ここにおいて、0、1、2、または3個の各環の原子は置換基により置換されていてもよい。

【0045】

「ヘテロアリール」なる用語は、単環ならば1～3個のヘテロ原子、二環ならば1～6個のヘテロ原子、三環ならば1～9個のヘテロ原子を有する、芳香族5～8員単環、8～12員二環、または11～14員三環式環系を意味し、前記ヘテロ原子は、O、N、またはSから選択され（例えば、炭素原子および、単環、二環、または三環ならば、それぞれ1～3、1～6、または1～9個のN、OまたはSのヘテロ原子）、ここにおいて、0、1、2、3、または4個の各環の原子は置換基により置換されていてもよい。

10

【0046】

「オキソ」なる用語は、炭素と結合した場合にカルボニルを形成し、窒素と結合した場合にN-オキシドを形成し、硫黄と結合した場合にスルホキシドまたはスルホンを形成する酸素原子である。

「アシル」なる用語は、アルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、アリールカルボニル、ヘテロサイクルカルボニルまたはヘテロアリールカルボニルであり、その任意のものは置換基によりさらに置換されていてもよい。

20

【0047】

「置換基」なる用語は、基の任意の原子のアルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリール基で「置換された」基を意味する。好適な置換基としては、制限なく、ハロゲン、CN、NO₂、OR⁵、SR⁵、S(O)₂OR⁵、NR⁵R⁶、C₁-C₂パーフルオロアルキル、C₁-C₂パーフルオロアルコキシ、1,2-メチレンジオキシ、C(O)OR⁵、C(O)NR⁵R⁶、OC(O)NR⁵R⁶、NR⁵C(O)NR⁵R⁶、C(NR⁶)NR⁵R⁶、NR⁵C(NR⁶)NR⁵R⁶、S(O)₂NR⁵R⁶、R⁷、C(O)R⁷、NR⁵C(O)R⁷、S(O)R⁷、またはS(O)₂R⁷が挙げられる。各R⁵は、独立して、水素、C₁-C₄アルキル、またはC₃-C₆シクロアルキルである。各R⁶は独立して、水素、C₃-C₆シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、ヘテロアリール、C₁-C₄アルキル、あるいはC₃-C₆シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールで置換されたC₁-C₄アルキルである。各R⁷は独立して、C₃-C₆シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、ヘテロアリール、C₁-C₄アルキル、あるいはC₃-C₆シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、またはヘテロアリールで置換されたC₁-C₄アルキルである。各R⁵、R⁶およびR⁷における各C₃-C₆シクロアルキル、アリール、ヘテロサイクリル、ヘテロアリールおよびC₁-C₄アルキルは所望により、ハロゲン、CN、C₁-C₄アルキル、OH、C₁-C₄アルコキシ、NH₂、C₁-C₄アルキルアミノ、C₁-C₄ジアルキルアミノ、C₁-C₂パーフルオロアルキル、C₁-C₂パーフルオロアルコキシ、または1,2-メチレンジオキシで置換されていてもよい。

30

40

【0048】

他の態様において、ある基の置換基は、独立して、水素、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、SO₃H、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、アルキル（C₁-C₆直鎖または分枝鎖）、アルコキシ（C₁-C₆直鎖または分枝鎖）、O-ベンジル、O-フェニル、フェニル、1,2-メチレンジオキシ、カルボキシル、モルホリニル、ピペリジニル、アミノまたはOC(O)NR⁵R⁶である。各R⁵およびR⁶は前記のとおりである。

【0049】

「治療する」または「治療された」なる用語は、疾患、または疾患の症状、または疾患

50

の傾向を治療、治癒、緩和、軽減、変更、矯正、改良、改善または影響を及ぼす目的で、本明細書に記載される化合物を対象者に投与することである。

「有効量」とは、治療される対象者に対して治療的效果を付与する化合物の量を意味する。治療効果は、客観的（すなわち、試験またはマーカーにより測定可能）、または客観的（すなわち、対象者が効果の徴候を示すか、または効果を感じる）であり得る。前記化合物の有効量は、約 0.1 mg/Kg ～ 約 500 mg/Kg の範囲である。有効量は、投与経路、ならびに他の薬剤の同時使用の可能性によっても変わる。

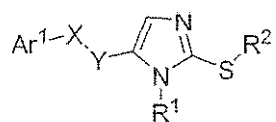
【0050】

組成物および方法において有用な代表的化合物を示す：

【0051】

【表 1】

表 A1A



Cpd. No.	Ar ¹ -X-Y	R ¹	R ²
A1			
A2			
A3			
A4			
A5			
A6			
A7			
A8			
A9			
A10			
A11			
A12			
A13			
A14			

10

20

30

40

【表 2】

A15			
A16			
A17			
A18			
A19			
A20			
A21			
A22			
A23			
A24			
A25			
A26			
A27			
A28			
A29			
A30			
A31			
A32			

10

20

30

40

【表 3】

A33			
A34			
A35			
A36			
A37			
A38			
A39			
A40			
A41			
A42			
A43			
A44			
A45			
A46			
A47			
A48			
A49			
A50			

10

20

30

40

【表 4】

A51			
A52			
A53			
A54			
A55			
A56			
A57			
A58			
A59			
A60			
A61			
A62			
A63			
A64			
A65			
A66			

10

20

30

40

【表 5】

A67			
A68			
A69			
A70			
A71			
A72			
A73			
A74			
A75			
A76			
A77			
A78			
A79			
A80			
A81			
A82			
A83			

10

20

30

40

【表 6】

A84			
A85			
A86			
A87			
A88			
A89			
A90			
A91			
A92			
A93			
A94			
A95			
A96			
A97			
A98			
A99			
A100			

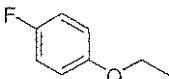
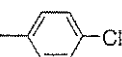
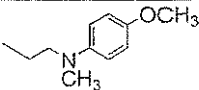
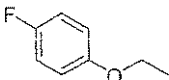
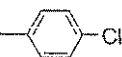
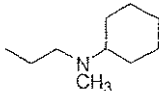
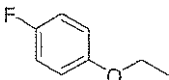
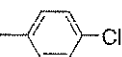
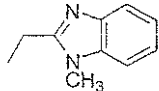
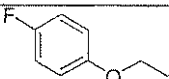
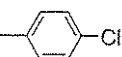
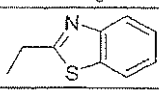
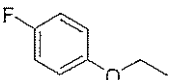
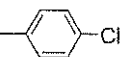
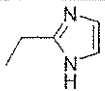
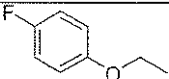
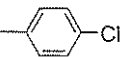
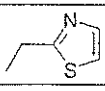
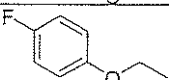
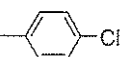
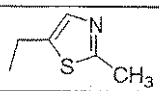
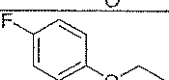
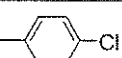
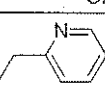
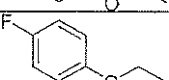
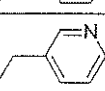
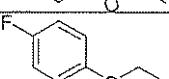
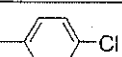
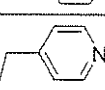
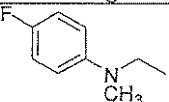
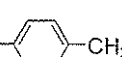
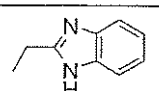
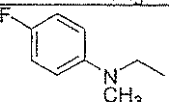
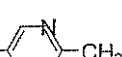
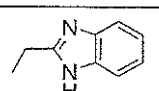
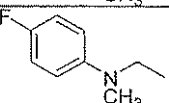
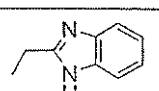
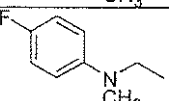
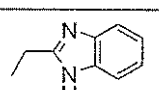
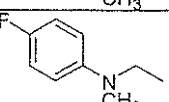
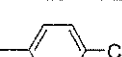
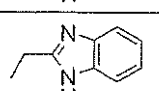
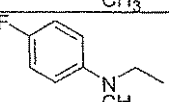
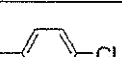
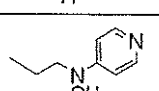
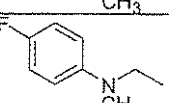
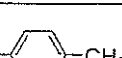
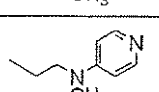
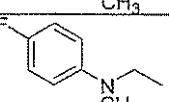
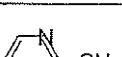
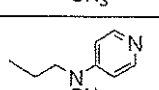
10

20

30

40

【表 7】

A101			
A102			
A103			
A104			
A105			
A106			
A107			
A108			
A109			
A110			
A111			
A112			
A113		CH ₃	
A114			
A115			
A116			
A117			
A118			

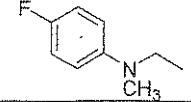
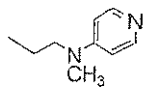
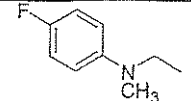
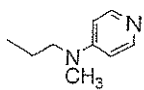
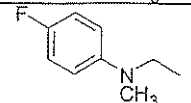
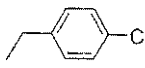
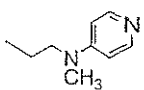
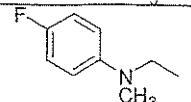
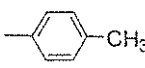
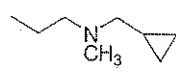
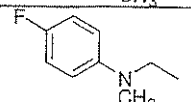
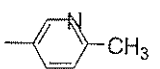
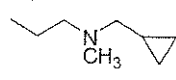
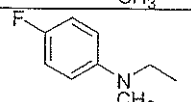
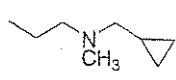
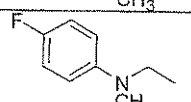
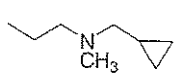
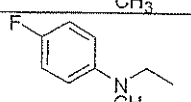
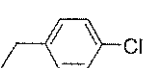
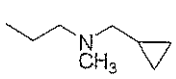
10

20

30

40

【表 8】

A119		CH_3	
A120			
A121			
A122			
A123			
A124		CH_3	
A125			
A126			

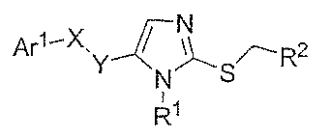
10

20

【 0 0 5 9 】

【表 9】

表 A1B



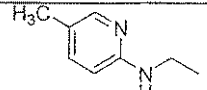
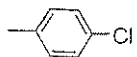
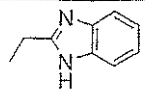
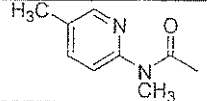
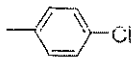
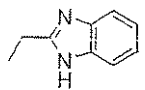
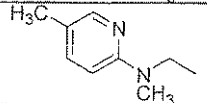
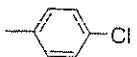
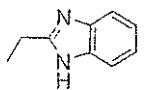
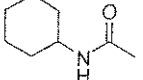
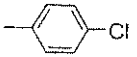
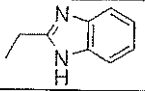
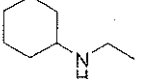
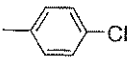
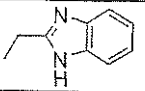
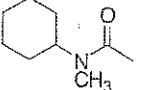
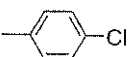
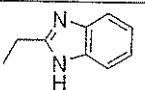
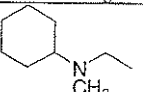
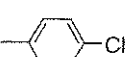
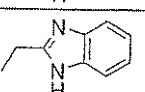
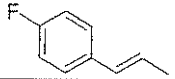
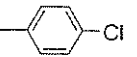
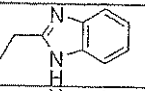
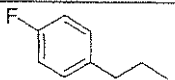
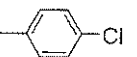
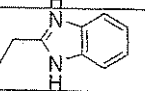
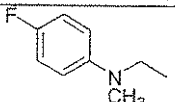
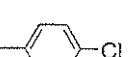
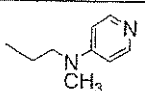
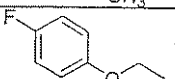
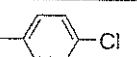
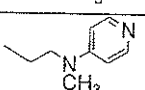
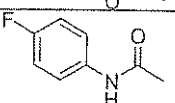
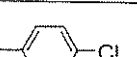
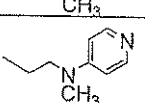
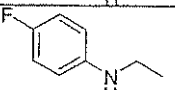
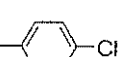
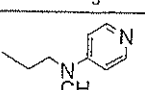
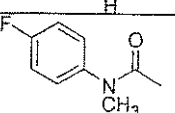
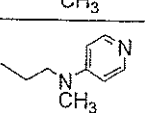
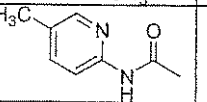
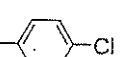
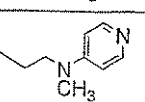
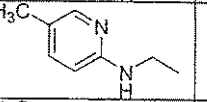
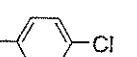
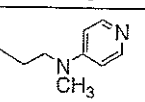
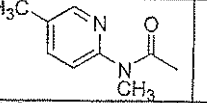
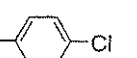
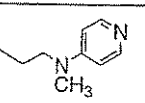
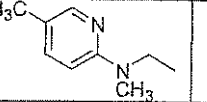
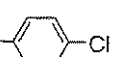
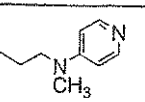
Cpd. No.	Ar ¹ -X-Y	R ¹	R ²
A127			
A128			
A129			
A130			
A131			
A132			

10

20

【0060】

【表 10】

A133			
A134			
A135			
A136			
A137			
A138			
A139			
A140			
A141			
A142			
A143			
A144			
A145			
A146			
A147			
A148			
A149			
A150			

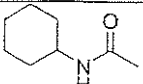
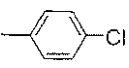
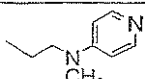
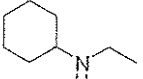
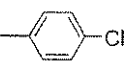
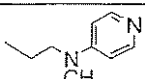
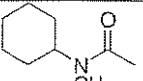
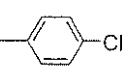
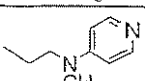
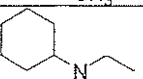
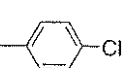
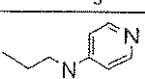
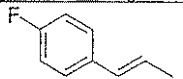
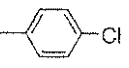
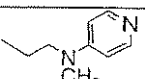
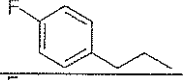
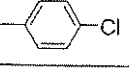
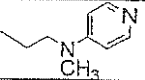
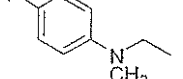
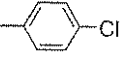
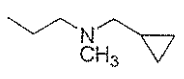
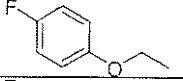
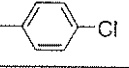
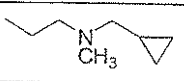
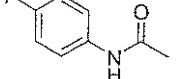
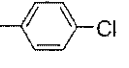
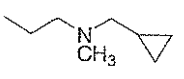
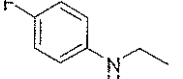
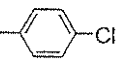
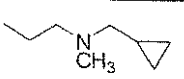
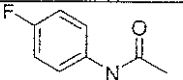
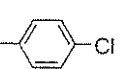
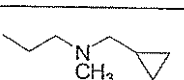
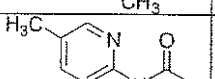
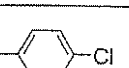
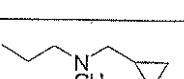
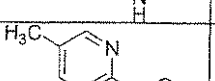
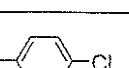
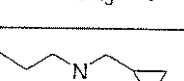
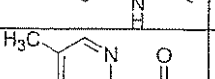
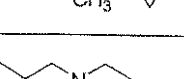
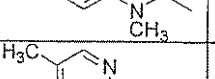
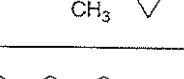
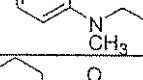
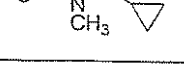
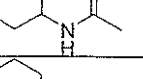
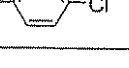
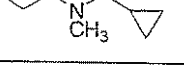
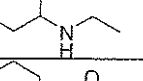
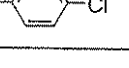
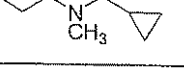
10

20

30

40

【表 1 1】

A151			
A152			
A153			
A154			
A155			
A156			
A157			
A158			
A159			
A160			
A161			
A162			
A163			
A164			
A165			
A166			
A167			
A168			

10

20

30

40

【表 1 2】

A169			
A170			
A171			
A172			
A173			
A174			
A175			
A176			
A177			
A178			
A179			
A180			
A181			
A182			
A183			
A184			
A185			

10

20

30

40

【表 1 3】

A186			
A187			
A188			
A189			
A190			
A191			
A192			
A193			
A194			
A195			
A196			
A197			
A198			
A199			
A200			
A201			

10

20

30

40

【表 1 4】

A202			
A203			
A204			
A205			
A206			
A207			
A208			
A209			
A210			
A211			
A212			
A213			
A214			
A215			
A216			
A217			
A218			

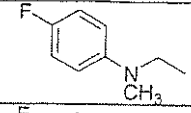
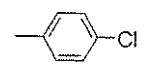
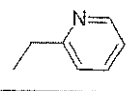
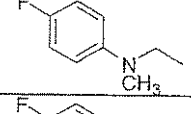
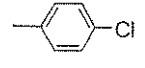
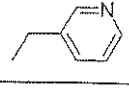
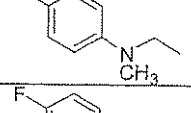
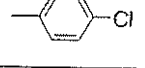
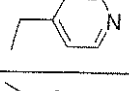
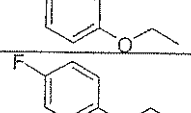
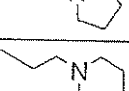
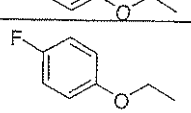
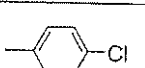
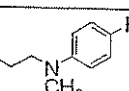
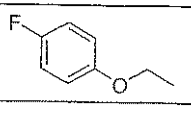
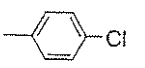
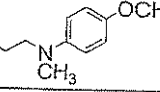
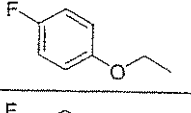
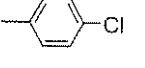
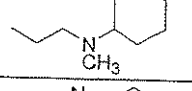
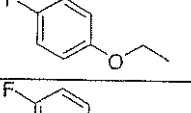
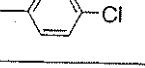
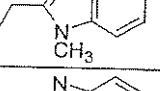
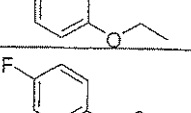
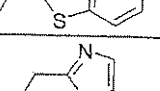
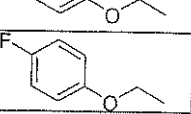
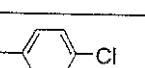
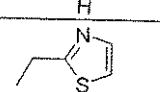
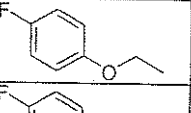
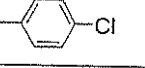
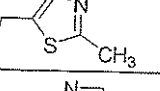
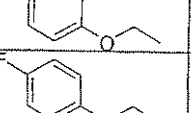
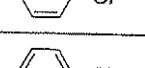
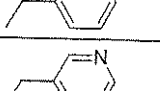
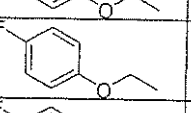
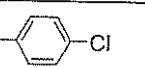
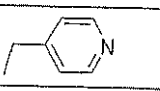
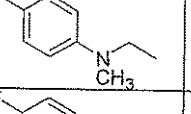
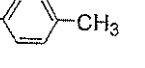
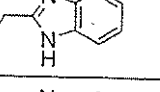
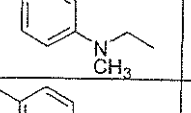
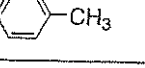
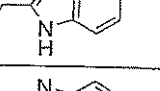
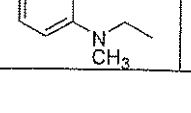
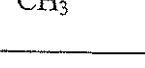
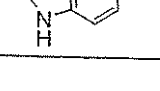
10

20

30

40

【表 1 5】

A219			
A220			
A221			
A222			
A223			
A224			
A225			
A226			
A227			
A228			
A229			
A230			
A231			
A232			
A233			
A234			
A235			
A236			
A237			

10

20

30

40

【表 1 6】

A238			
A239			
A240			
A241			
A242			
A243		CH_3	
A244			
A245			
A246			
A247			
A248		CH_3	
A249			
A250			

10

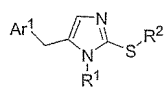
20

30

【 0 0 6 7 】

【表 1 7】

表 A1C



Cpd. No.	Ar ¹	R ¹	R ²
A251			
A252			
A253			
A254			
A255			
A256			
A257			
A258			
A259			
A260			
A261			
A262			
A263			
A264			
A265			
A266			

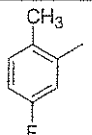
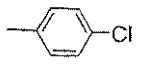
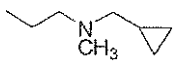
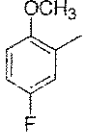
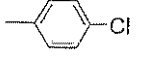
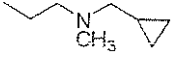
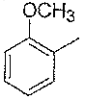
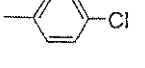
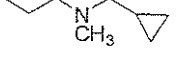
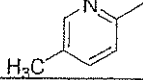
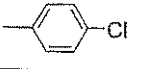
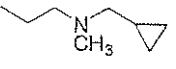
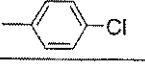
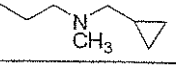
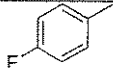
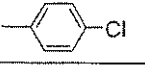
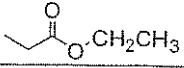
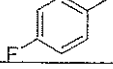
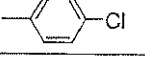
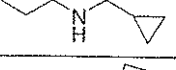
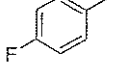
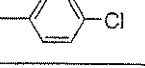
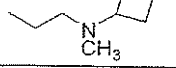
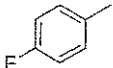
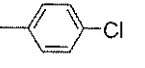
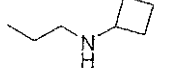
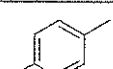
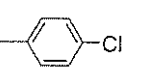
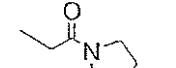
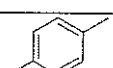
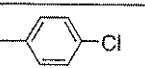
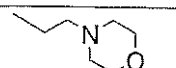
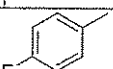
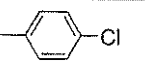
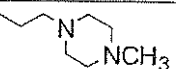
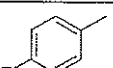
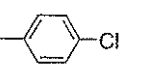
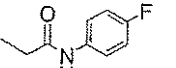
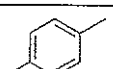
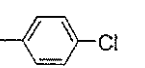
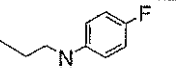
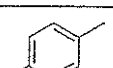
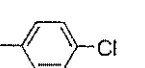
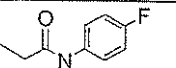
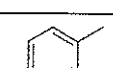
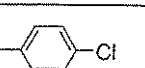
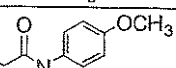
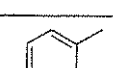
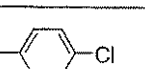
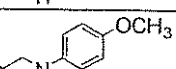
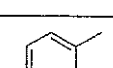
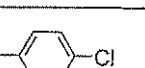
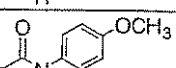
10

20

30

【0068】

【表 18】

A267			
A268			
A269			
A270			
A271			
A272			
A273			
A274			
A275			
A276			
A277			
A278			
A279			
A280			
A281			
A282			
A283			
A284			

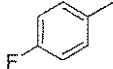
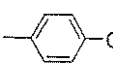
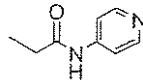
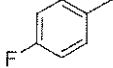
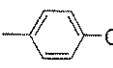
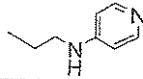
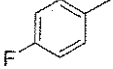
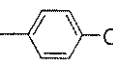
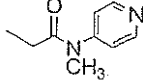
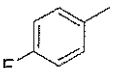
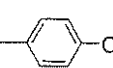
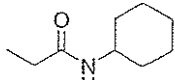
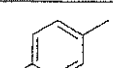
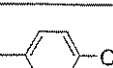
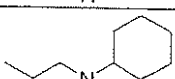
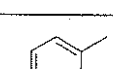
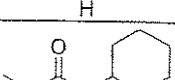
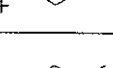
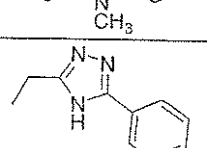
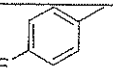
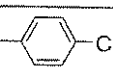
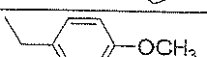
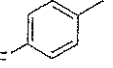
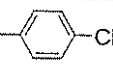
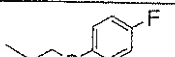
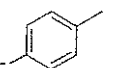
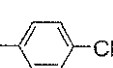
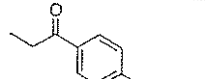
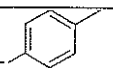
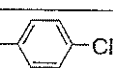
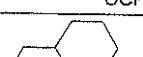
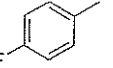
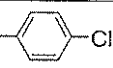
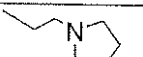
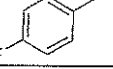
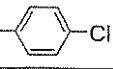
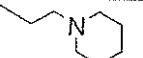
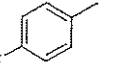
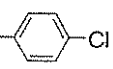
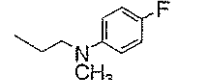
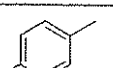
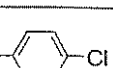
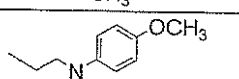
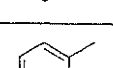
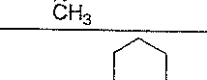
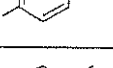
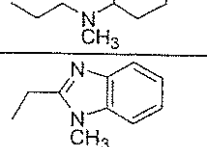
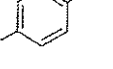
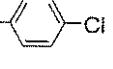
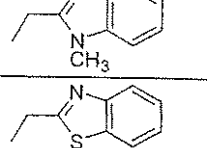
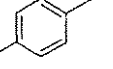
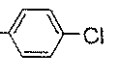
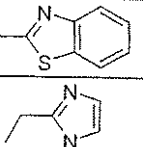
10

20

30

40

【表 19】

A285			
A286			
A287			
A288			
A289			
A290			
A291			
A292			
A293			
A294			
A295			
A296			
A297			
A298			
A299			
A300			
A301			
A302			
A303			

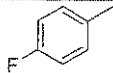
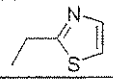
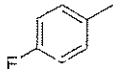
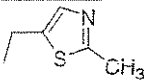
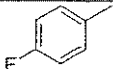
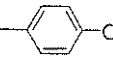
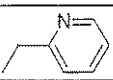
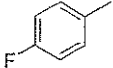
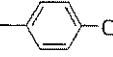
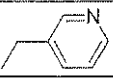
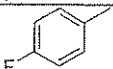
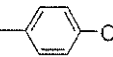
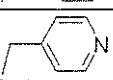
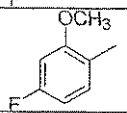
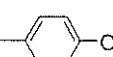
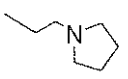
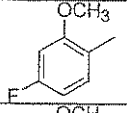
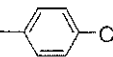
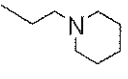
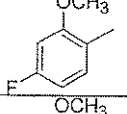
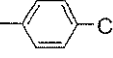
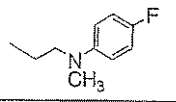
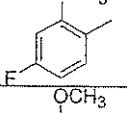
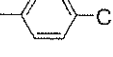
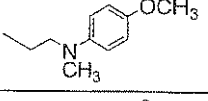
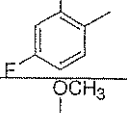
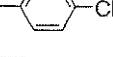
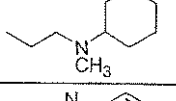
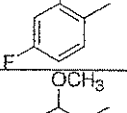
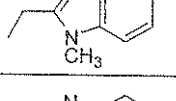
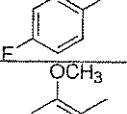
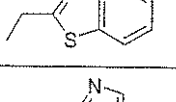
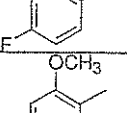
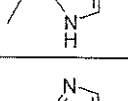
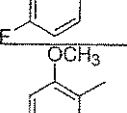
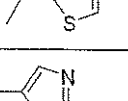
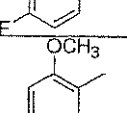
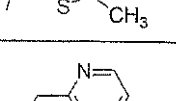
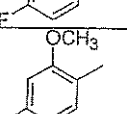
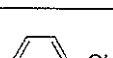
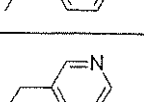
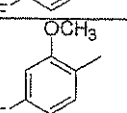
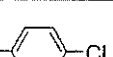
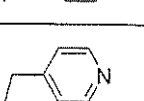
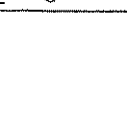
10

20

30

40

【表 20】

A304			
A305			
A306			
A307			
A308			
A309			
A310			
A311			
A312			
A313			
A314			
A315			
A316			
A317			
A318			
A319			
A320			
A321			

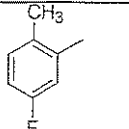
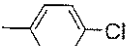
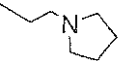
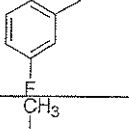
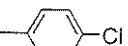
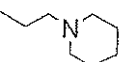
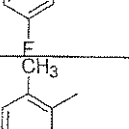
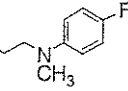
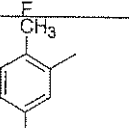
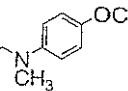
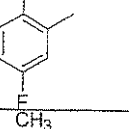
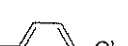
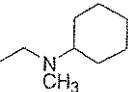
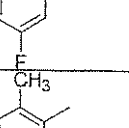
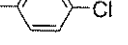
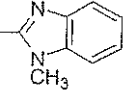
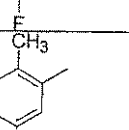
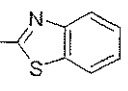
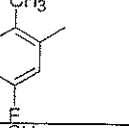
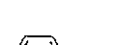
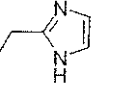
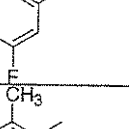
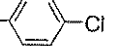
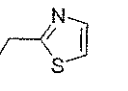
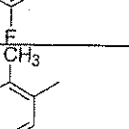
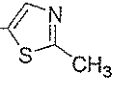
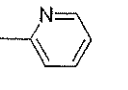
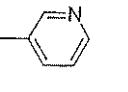
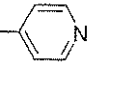
10

20

30

40

【表 2 1】

A322			
A323			
A324			
A325			
A326			
A327			
A328			
A329			
A330			
A331			
A332			
A333			
A334			

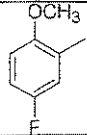
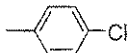
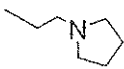
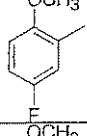
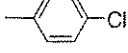
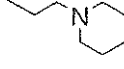
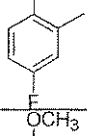
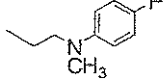
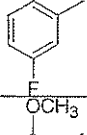
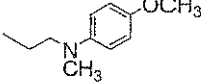
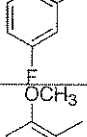
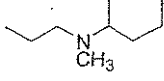
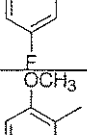
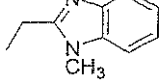
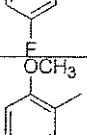
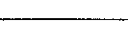
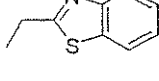
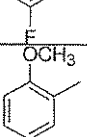
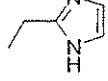
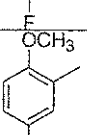
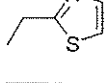
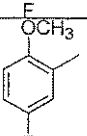
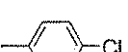
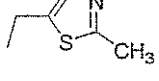
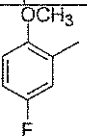
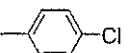
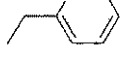
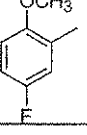
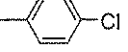
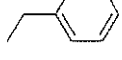
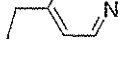
10

20

30

40

【表 2 2】

A335			
A336			
A337			
A338			
A339			
A340			
A341			
A342			
A343			
A344			
A345			
A346			
A347			

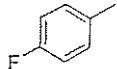
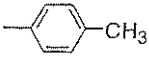
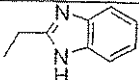
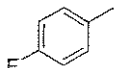
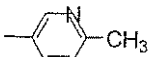
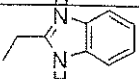
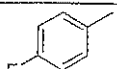
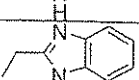
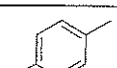
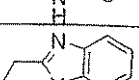
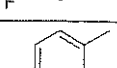
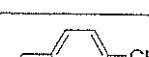
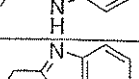
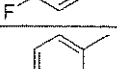
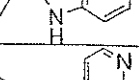
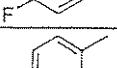
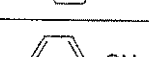
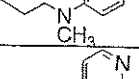
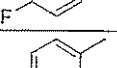
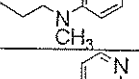
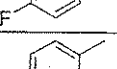
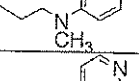
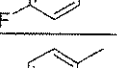
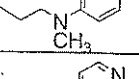
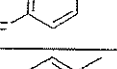
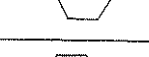
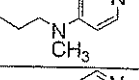
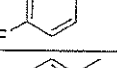
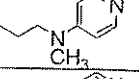
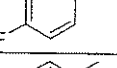
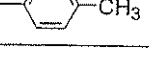
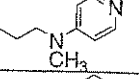
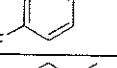
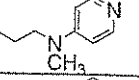
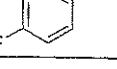
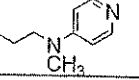
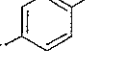
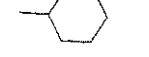
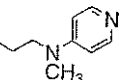
10

20

30

40

【表 2 3】

A348			
A349			
A350		CH ₃	
A351			
A352			
A353			
A354			
A355			
A356		CH ₃	
A357			
A358			
A359			
A360			
A361		CH ₃	
A362			
A363			

10

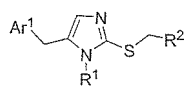
20

30

【 0 0 7 4 】

【表 2 4】

表 A1D



Cpd no.	Ar ¹	R ¹	R ²
A364			
A365			
A366			
A367			
A368			
A369			
A370			
A371			
A372			
A373			
A374			
A375			
A376			
A377			
A378			
A379			

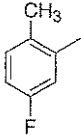
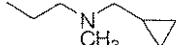
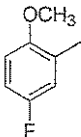
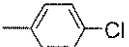
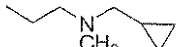
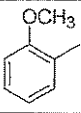
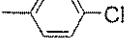
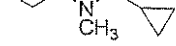
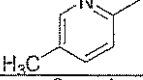
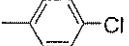
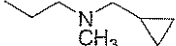
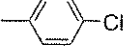
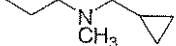
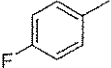
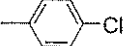
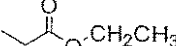
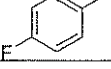
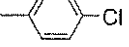
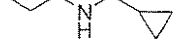
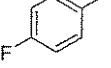
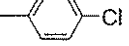
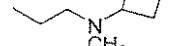
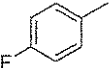
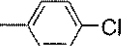
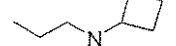
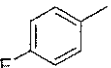
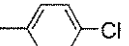
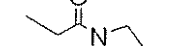
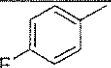
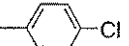
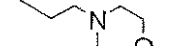
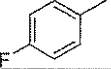
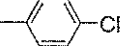
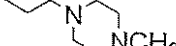
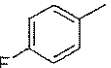
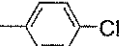
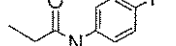
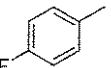
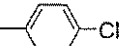
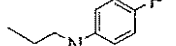
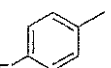
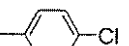
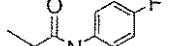
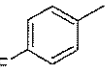
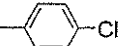
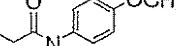
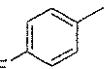
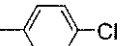
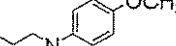
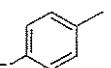
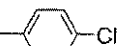
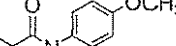
10

20

30

【0075】

【表 2 5】

A380			
A381			
A382			
A383			
A384			
A385			
A386			
A387			
A388			
A389			
A390			
A391			
A392			
A393			
A394			
A395			
A396			
A397			

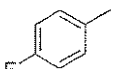
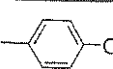
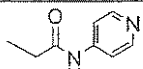
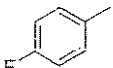
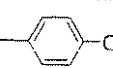
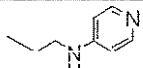
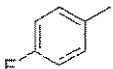
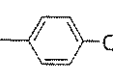
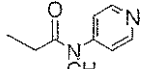
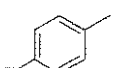
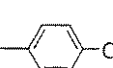
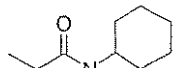
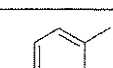
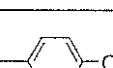
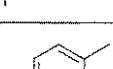
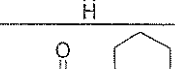
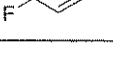
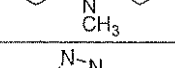
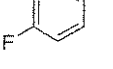
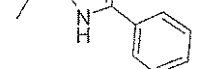
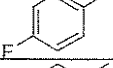
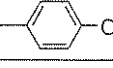
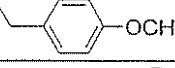
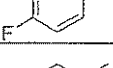
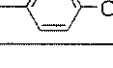
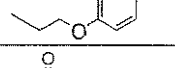
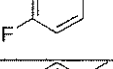
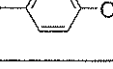
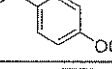
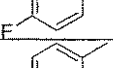
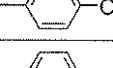
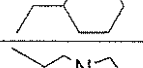
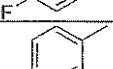
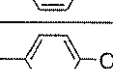
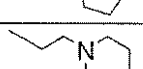
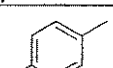
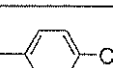
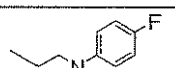
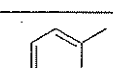
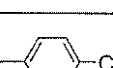
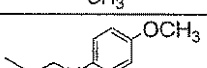
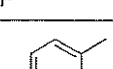
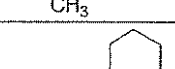
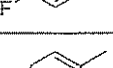
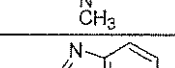
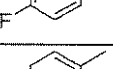
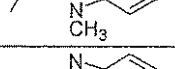
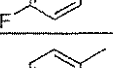
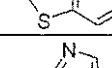
10

20

30

40

【表 2 6】

A398			
A399			
A400			
A401			
A402			
A403			
A404			
A405			
A406			
A407			
A408			
A409			
A410			
A411			
A412			
A413			
A414			
A415			
A416			

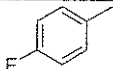
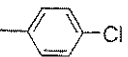
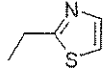
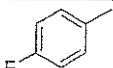
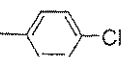
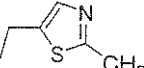
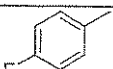
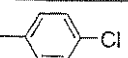
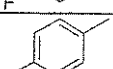
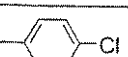
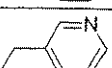
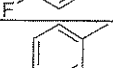
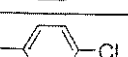
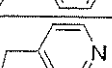
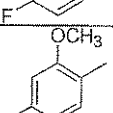
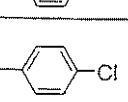
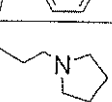
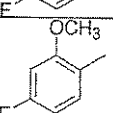
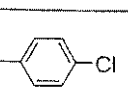
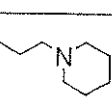
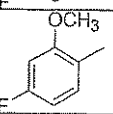
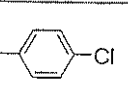
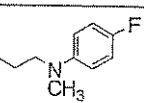
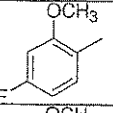
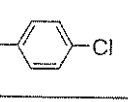
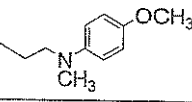
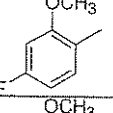
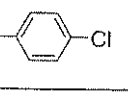
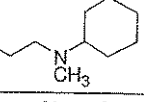
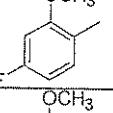
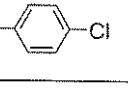
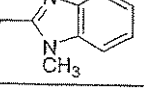
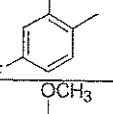
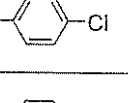
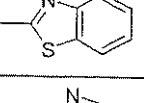
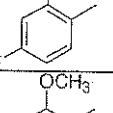
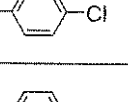
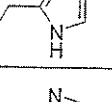
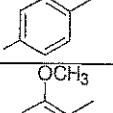
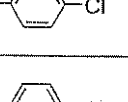
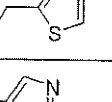
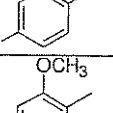
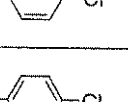
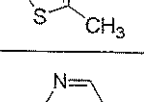
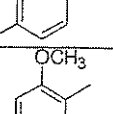
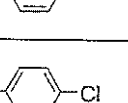
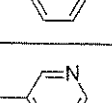
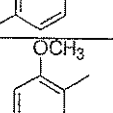
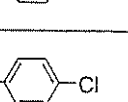
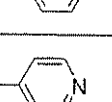
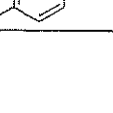
10

20

30

40

【表 2 7】

A417			
A418			
A419			
A420			
A421			
A422			
A423			
A424			
A425			
A426			
A427			
A428			
A429			
A430			
A431			
A432			
A433			
A434			

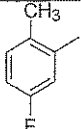
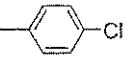
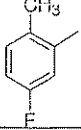
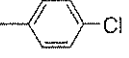
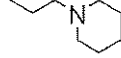
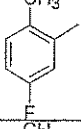
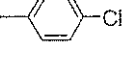
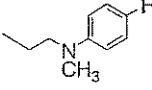
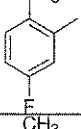
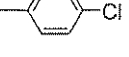
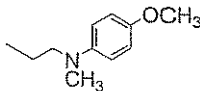
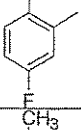
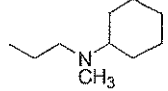
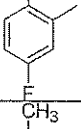
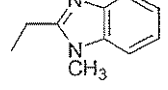
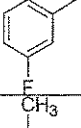
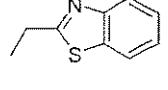
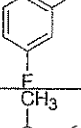
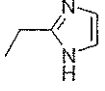
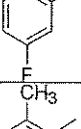
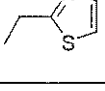
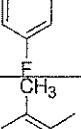
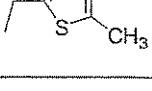
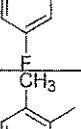
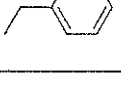
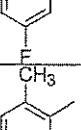
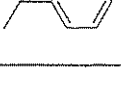
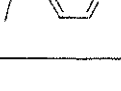
10

20

30

40

【表 2 8】

A435			
A436			
A437			
A438			
A439			
A440			
A441			
A442			
A443			
A444			
A445			
A446			
A447			

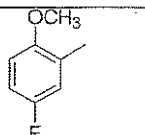
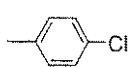
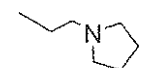
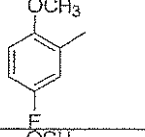
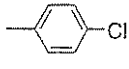
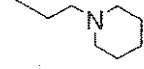
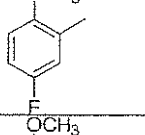
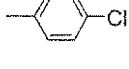
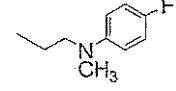
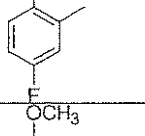
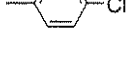
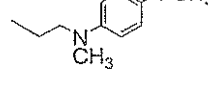
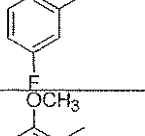
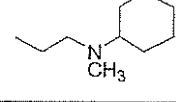
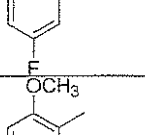
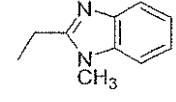
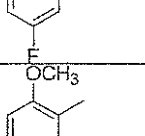
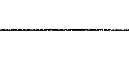
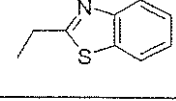
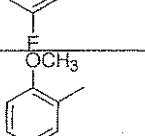
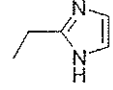
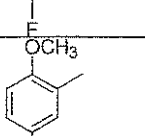
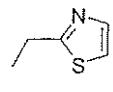
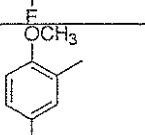
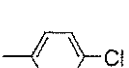
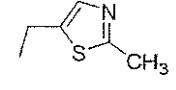
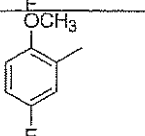
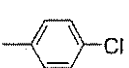
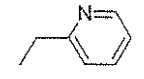
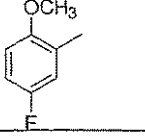
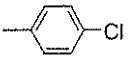
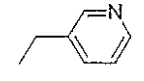
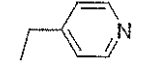
10

20

30

40

【表 2 9】

A448			
A449			
A450			
A451			
A452			
A453			
A454			
A455			
A456			
A457			
A458			
A459			
A460			

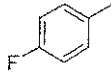
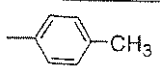
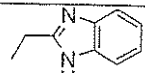
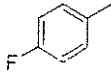
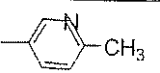
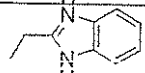
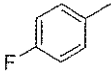
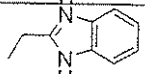
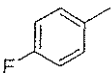
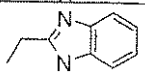
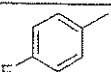
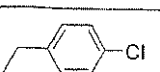
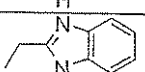
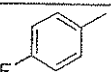
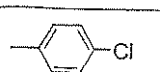
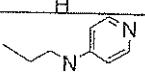
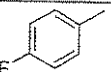
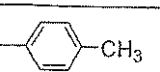
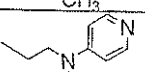
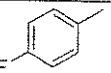
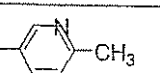
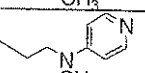
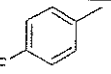
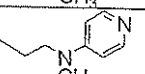
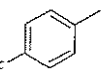
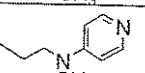
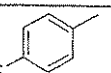
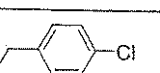
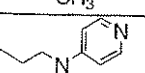
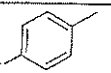
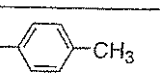
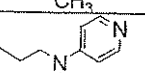
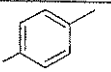
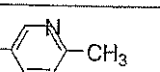
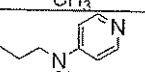
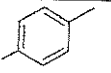
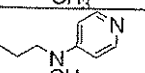
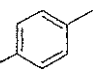
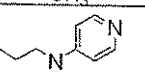
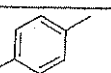
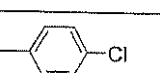
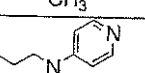
10

20

30

40

【表 3 0】

A461			
A462			
A463		CH ₃	
A464			
A465			
A466			
A467			
A468			
A469		CH ₃	
A470			
A471			
A472			
A473			
A474		CH ₃	
A475			
A476			

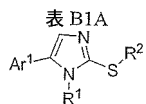
10

20

30

【0081】

【表 3 1】



Cpd No.	Ar ¹	R ¹	R ²
B1			
B2			
B3			
B4			
B5			
B6			
B7			
B8			
B9			
B10			硫黄は酸化して スルホキシドになる。
B11		Et	
B12			
B13			
B14			
B15			
B16			

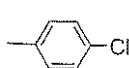
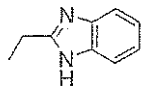
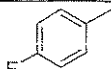
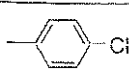
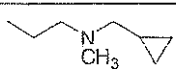
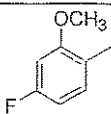
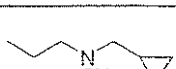
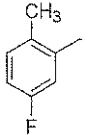
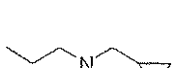
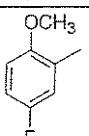
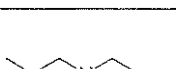
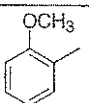
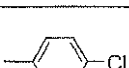
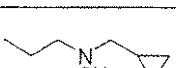
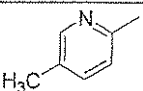
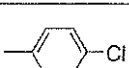
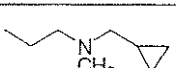
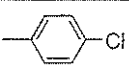
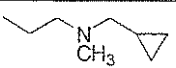
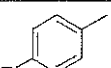
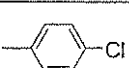
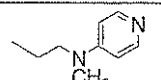
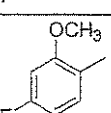
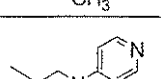
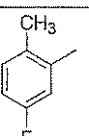
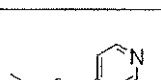
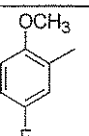
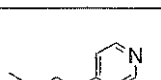
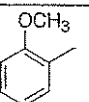
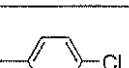
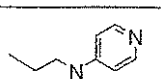
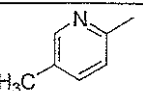
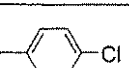
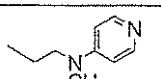
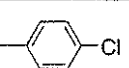
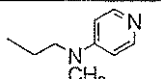
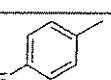
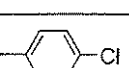
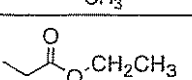
10

20

30

【0082】

【表 3 2】

B17			
B18			
B19			
B20			
B21			
B22			
B23			
B24			
B25			
B26			
B27			
B28			
B29			
B30			
B31			
B32			

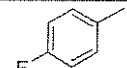
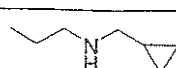
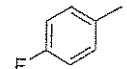
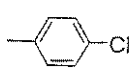
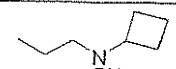
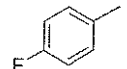
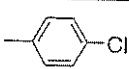
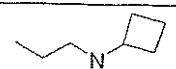
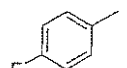
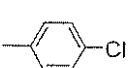
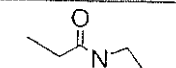
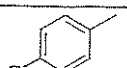
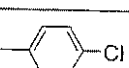
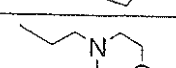
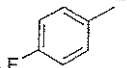
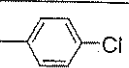
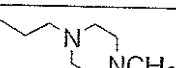
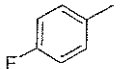
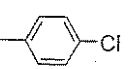
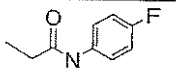
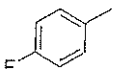
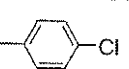
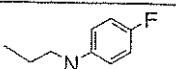
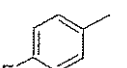
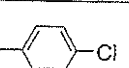
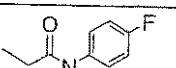
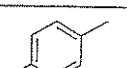
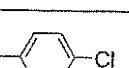
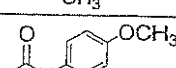
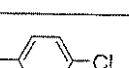
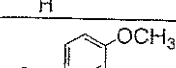
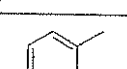
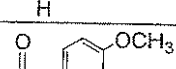
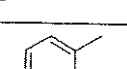
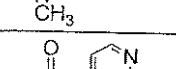
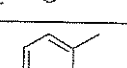
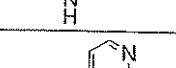
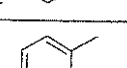
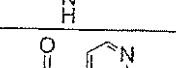
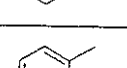
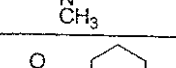
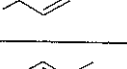
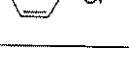
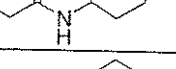
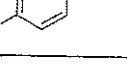
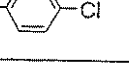
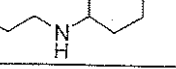
10

20

30

40

【表 3 3】

B33			
B34			
B35			
B36			
B37			
B38			
B39			
B40			
B41			
B42			
B43			
B44			
B45			
B46			
B47			
B48			
B49			
B50			

10

20

30

40

【表 3 4】

B51			
B52			
B53			
B54			
B55			
B56			
B57			
B58			
B59			
B60			
B61			
B62			
B63			
B64			
B65			
B66			
B67			
B68			

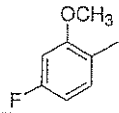
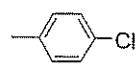
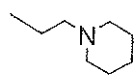
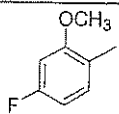
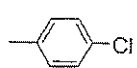
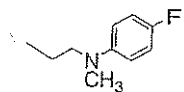
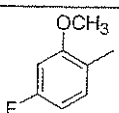
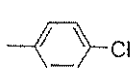
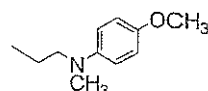
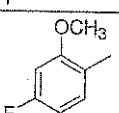
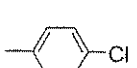
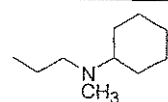
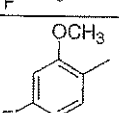
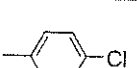
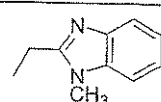
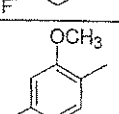
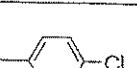
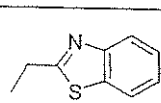
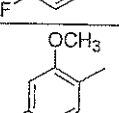
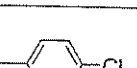
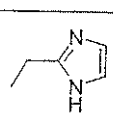
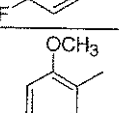
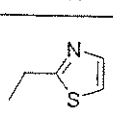
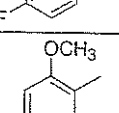
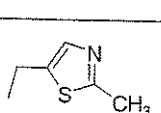
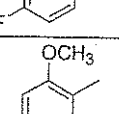
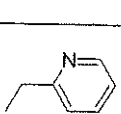
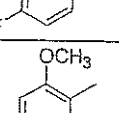
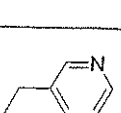
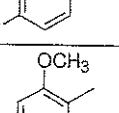
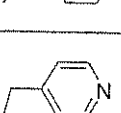
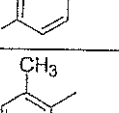
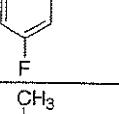
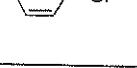
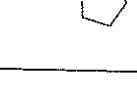
10

20

30

40

【表 3 5】

B69			
B70			
B71			
B72			
B73			
B74			
B75			
B76			
B77			
B78			
B79			
B80			
B81			
B82			

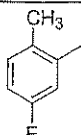
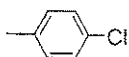
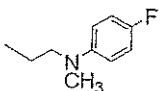
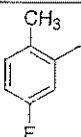
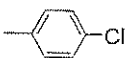
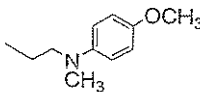
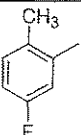
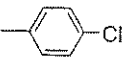
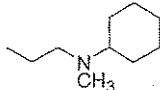
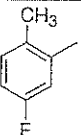
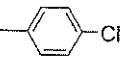
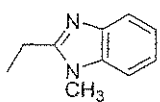
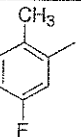
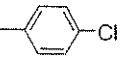
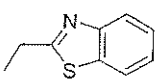
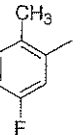
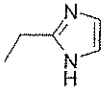
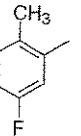
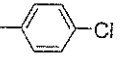
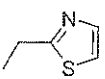
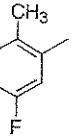
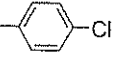
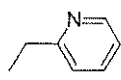
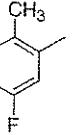
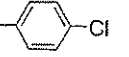
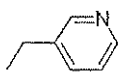
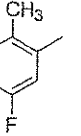
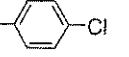
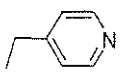
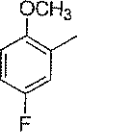
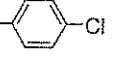
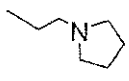
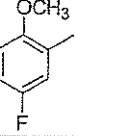
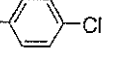
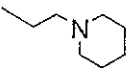
10

20

30

40

【表 3 6】

B83			
B84			
B85			
B86			
B87			
B88			
B89			
B90			
B91			
B92			
B93			
B94			

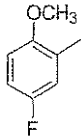
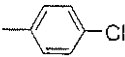
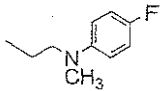
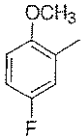
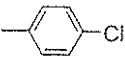
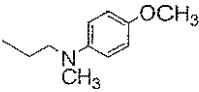
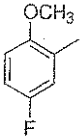
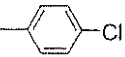
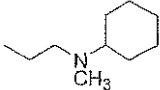
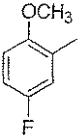
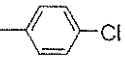
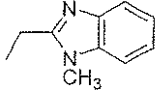
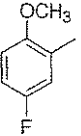
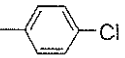
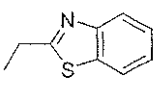
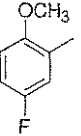
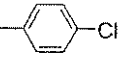
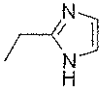
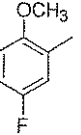
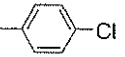
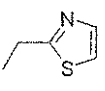
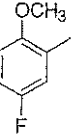
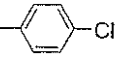
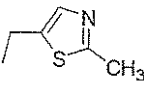
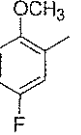
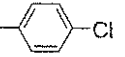
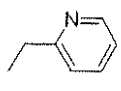
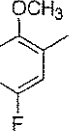
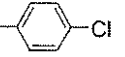
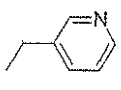
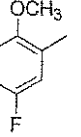
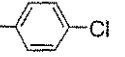
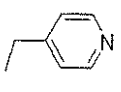
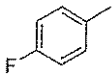
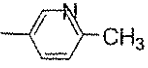
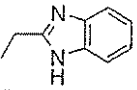
10

20

30

40

【表 3 7】

B95			
B96			
B97			
B98			
B99			
B100			
B101			
B102			
B103			
B104			
B105			
B106			

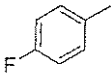
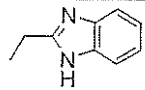
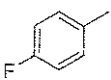
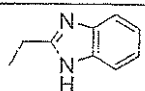
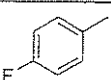
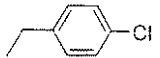
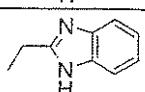
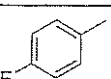
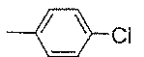
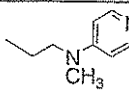
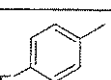
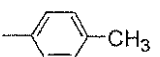
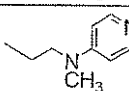
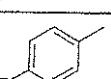
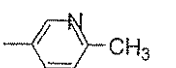
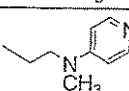
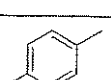
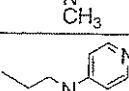
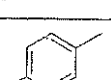
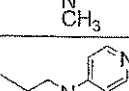
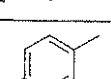
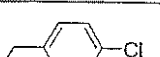
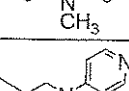
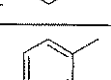
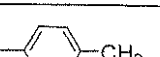
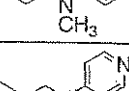
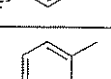
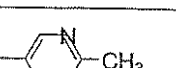
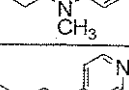
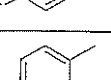
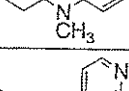
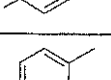
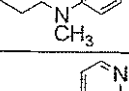
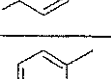
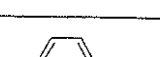
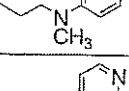
10

20

30

40

【表 3 8】

B107		CH ₃	
B108			
B109			
B110			
B111			
B112			
B113		CH ₃	
B114			
B115			
B116			
B117			
B118		CH ₃	
B119			
B120			

10

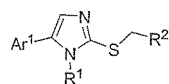
20

30

【0089】

【表 3 9】

表B1B



Cpd No.	Ar¹	R¹	R²
B121			
B122			
B123			
B124			
B125			
B126			
B127			
B128			
B129			
B130			
B131			
B132			
B133			
B134			
B135			
B136			

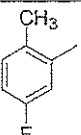
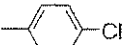
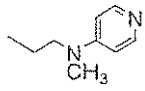
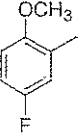
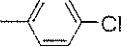
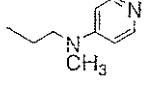
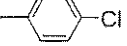
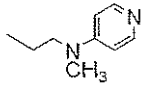
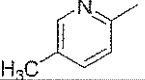
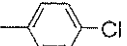
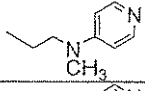
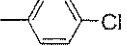
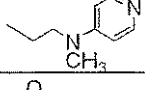
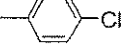
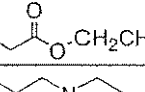
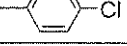
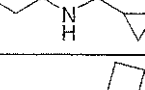
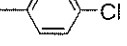
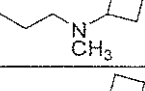
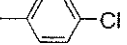
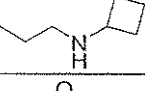
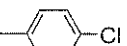
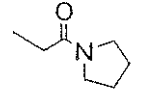
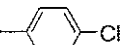
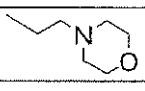
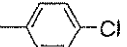
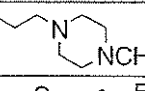
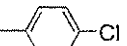
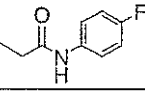
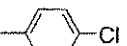
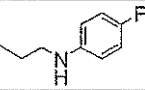
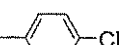
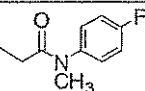
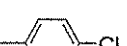
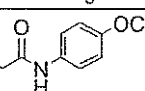
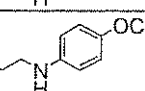
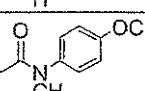
10

20

30

【0090】

【表 4 0】

B137			
B138			
B139			
B140			
B141			
B142			
B143			
B144			
B145			
B146			
B147			
B148			
B149			
B150			
B151			
B152			
B153			
B154			

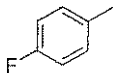
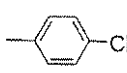
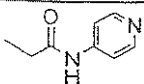
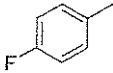
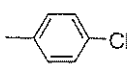
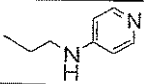
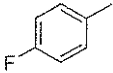
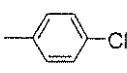
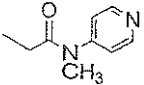
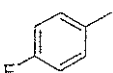
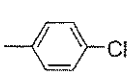
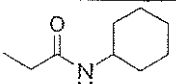
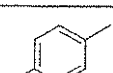
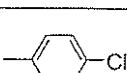
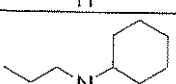
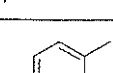
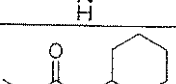
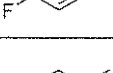
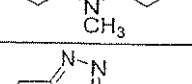
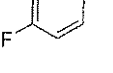
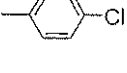
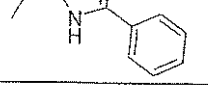
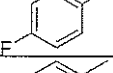
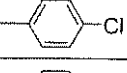
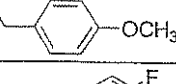
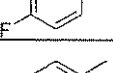
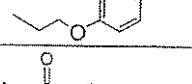
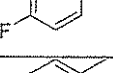
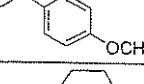
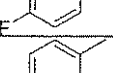
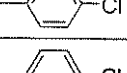
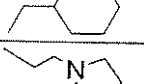
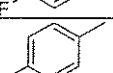
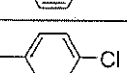
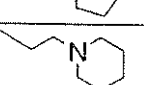
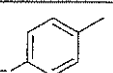
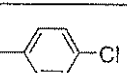
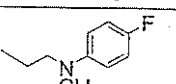
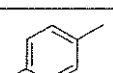
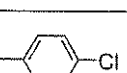
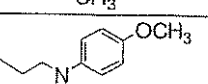
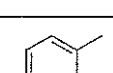
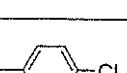
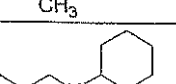
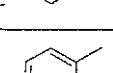
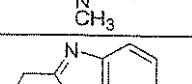
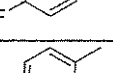
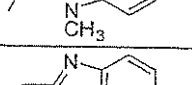
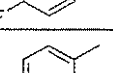
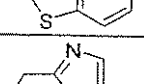
10

20

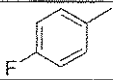
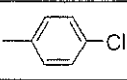
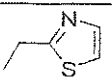
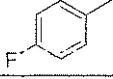
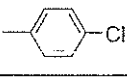
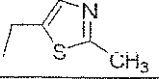
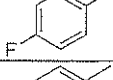
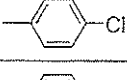
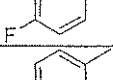
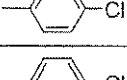
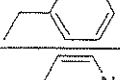
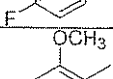
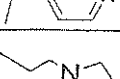
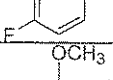
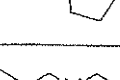
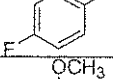
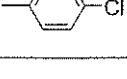
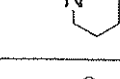
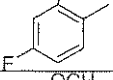
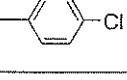
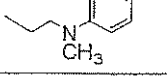
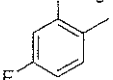
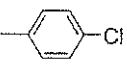
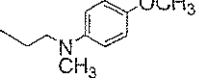
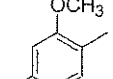
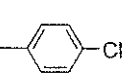
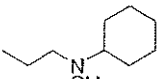
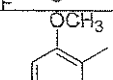
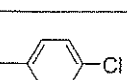
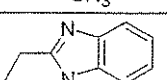
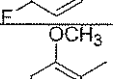
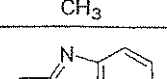
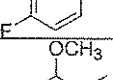
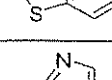
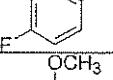
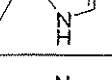
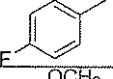
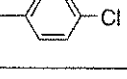
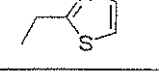
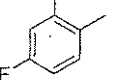
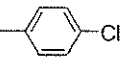
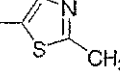
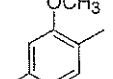
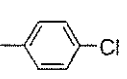
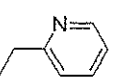
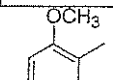
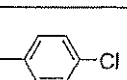
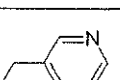
30

40

【表 4 1】

B155			
B156			
B157			
B158			
B159			
B160			
B161			
B162			
B163			
B164			
B165			
B166			
B167			
B168			
B169			
B170			
B171			
B172			
B173			

【表 4 2】

B174			
B175			
B176			
B177			
B178			
B179			
B180			
B181			
B182			
B183			
B184			
B185			
B186			
B187			
B188			
B189			
B190			
B191			

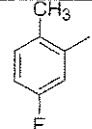
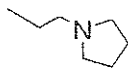
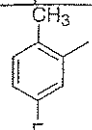
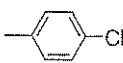
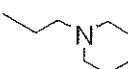
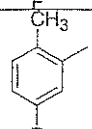
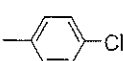
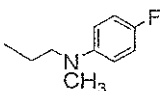
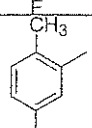
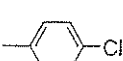
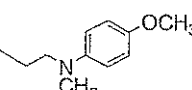
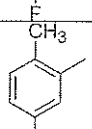
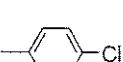
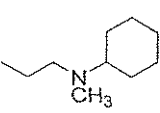
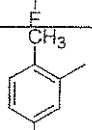
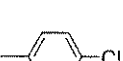
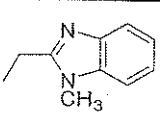
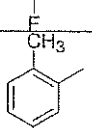
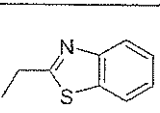
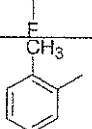
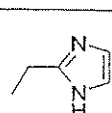
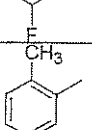
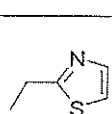
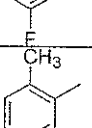
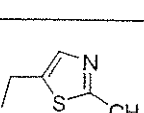
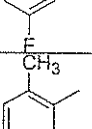
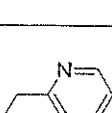
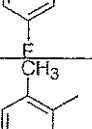
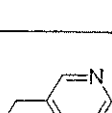
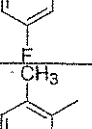
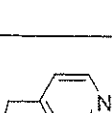
10

20

30

40

【表 4 3】

B192			
B193			
B194			
B195			
B196			
B197			
B198			
B199			
B200			
B201			
B202			
B203			
B204			

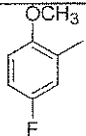
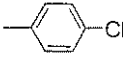
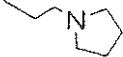
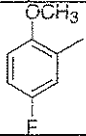
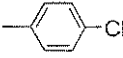
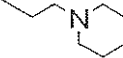
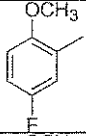
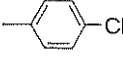
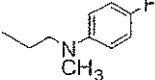
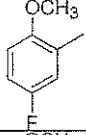
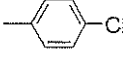
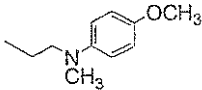
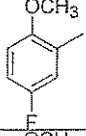
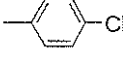
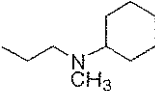
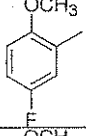
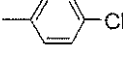
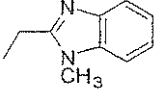
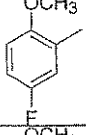
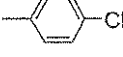
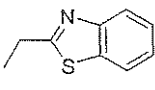
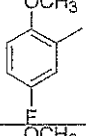
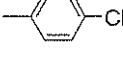
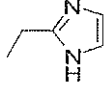
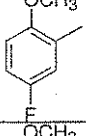
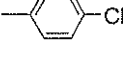
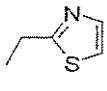
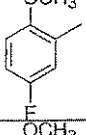
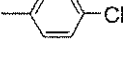
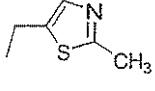
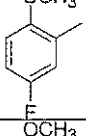
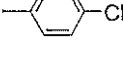
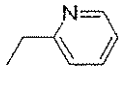
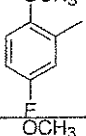
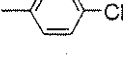
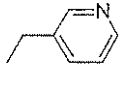
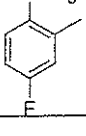
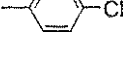
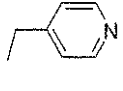
10

20

30

40

【表 4 4】

B205			
B206			
B207			
B208			
B209			
B210			
B211			
B212			
B213			
B214			
B215			
B216			
B217			

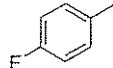
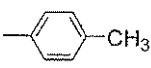
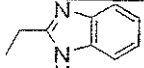
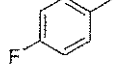
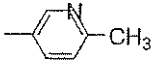
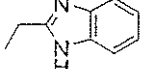
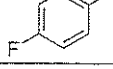
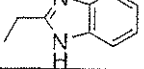
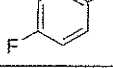
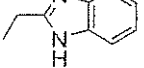
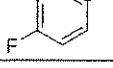
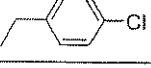
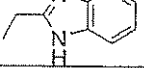
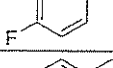
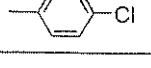
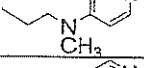
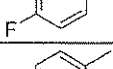
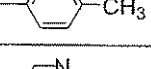
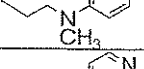
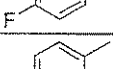
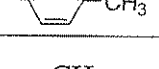
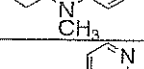
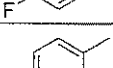
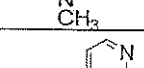
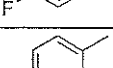
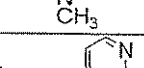
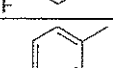
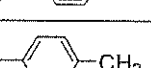
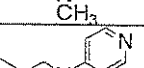
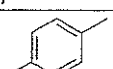
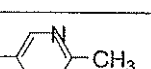
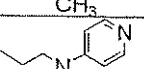
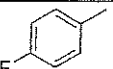
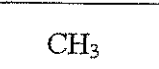
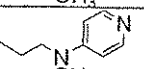
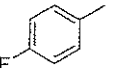
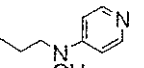
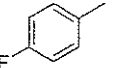
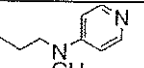
10

20

30

40

【表 4 5】

B218			
B219			
B220		CH ₃	
B221			
B222			
B223			
B224			
B225			
B226		CH ₃	
B227			
B228			
B229			
B230			
B231		CH ₃	
B232			
B233			

10

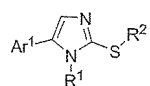
20

30

【0096】

【表 4 6】

表 B1C



Cpd No.	Ar ¹	R ¹	R ²
B234			
B235		CH ₃	
B236		CH ₃	
B237		CH ₃	
B238		CH ₃	
B239		Et	
B240		CH ₃	
B241		CH ₃	
B242		CH ₃	
B243			
B244		CH ₃	
B245		CH ₃	
B246			
B247			
B248			
B249			

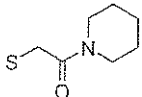
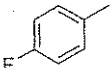
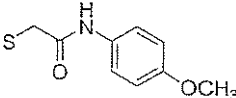
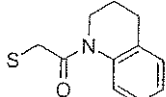
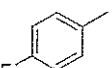
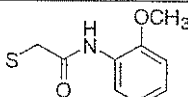
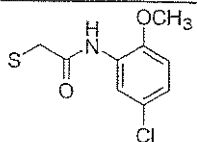
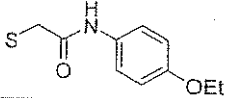
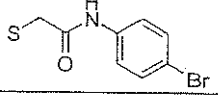
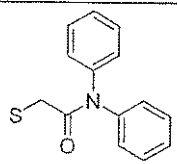
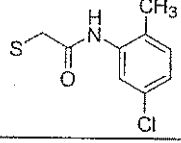
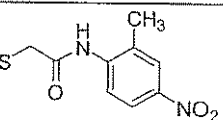
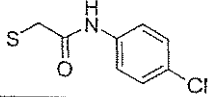
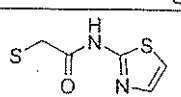
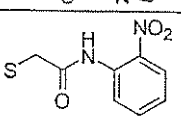
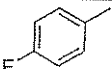
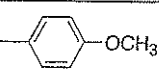
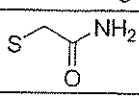
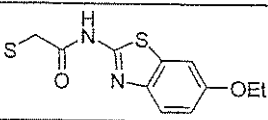
10

20

30

【 0 0 9 7 】

【表 4 7】

B250		CH ₃	
B251		CH ₃	
B252		Et	
B253		CH ₃	
B254		CH ₃	
B255		CH ₃	
B256		CH ₃	
B257		CH ₃	
B258		CH ₃	
B259		CH ₃	
B260		CH ₃	
B261		Et	
B262		CH ₃	
B263			
B264			

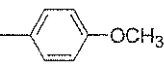
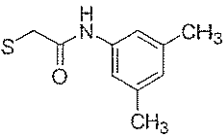
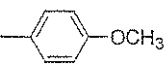
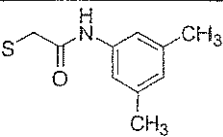
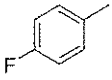
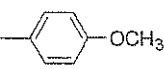
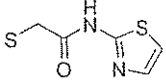
10

20

30

40

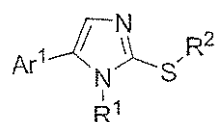
【表 4 8】

B265			
B266			
B267			

【 0 0 9 9 】

【表 4 9】

表 C1A



Cpd no.	Ar ¹	R ¹	R ²
C1			
C2			
C3			
C4			
C5			
C6			
C7			
C8			
C9			
C10			
C11			
C12			
C13			

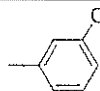
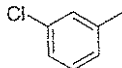
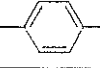
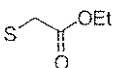
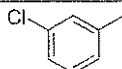
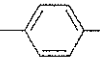
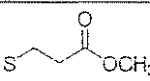
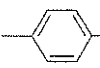
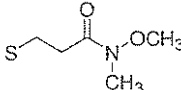
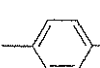
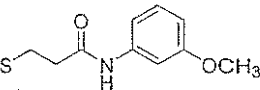
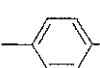
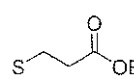
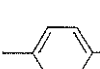
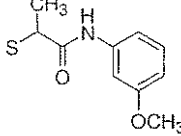
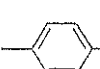
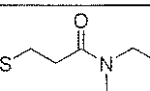
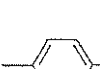
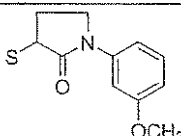
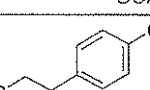
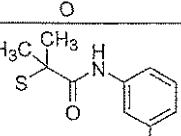
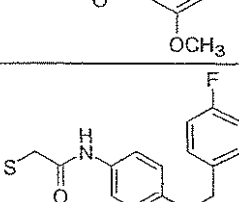
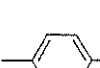
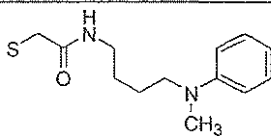
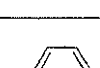
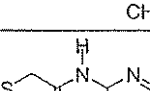
10

20

30

40

【表 5 0】

C14			
C15			
C16			
C17			
C18			
C19			
C20			
C21			
C22			
C23			
C24			
C25			
C26			
C27			

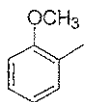
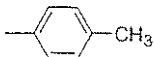
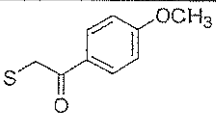
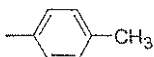
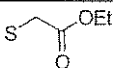
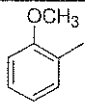
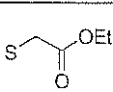
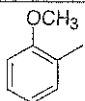
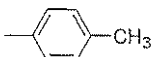
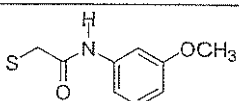
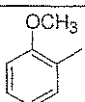
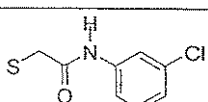
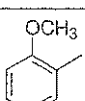
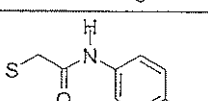
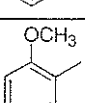
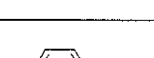
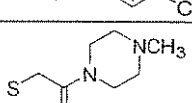
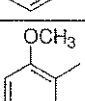
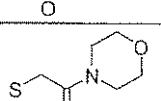
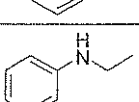
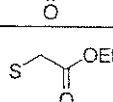
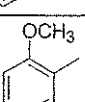
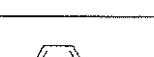
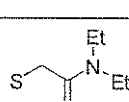
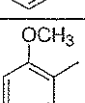
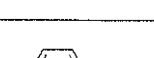
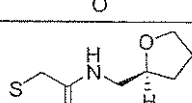
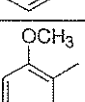
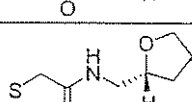
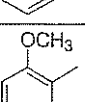
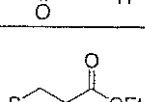
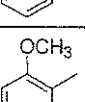
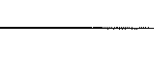
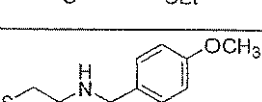
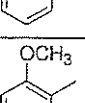
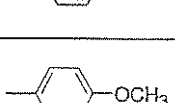
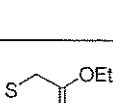
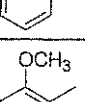
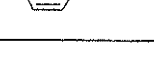
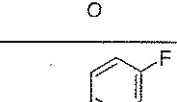
10

20

30

40

【表 5 1】

C28			
C29			
C30		CH ₃	
C31			
C32			
C33			
C34			
C35			
C36			
C37			
C38			
C39			
C40		CH ₃	
C41			
C42			
C43			

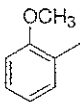
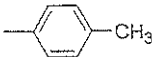
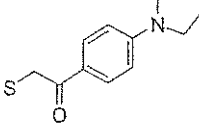
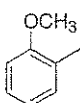
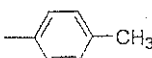
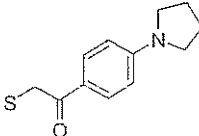
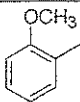
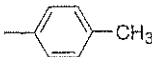
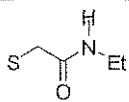
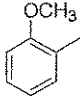
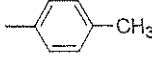
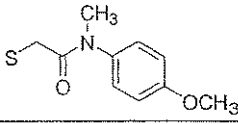
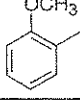
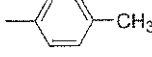
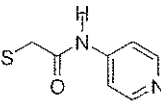
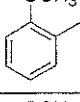
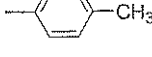
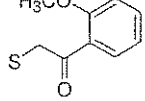
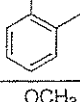
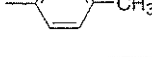
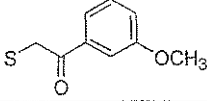
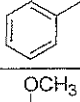
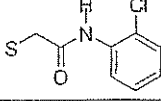
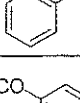
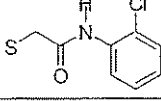
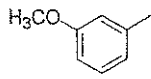
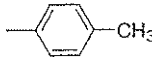
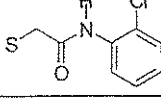
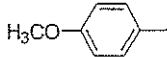
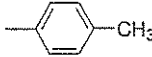
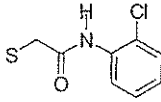
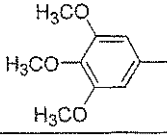
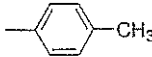
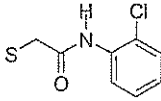
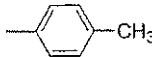
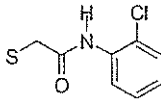
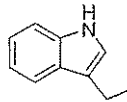
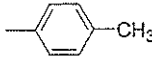
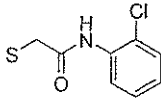
10

20

30

40

【表 5 2】

C44			
C45			
C46			
C47			
C48			
C49			
C50			
C51			
C52			
C53			
C54			
C55			
C56			
C57			

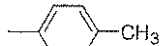
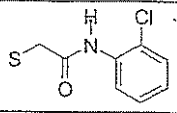
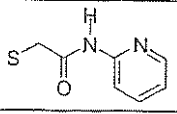
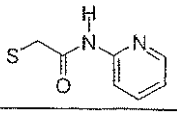
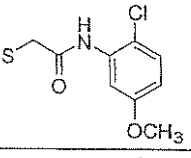
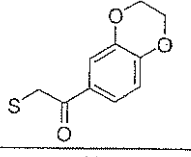
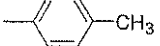
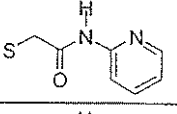
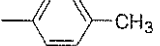
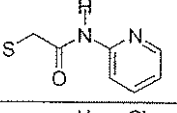
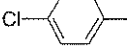
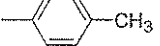
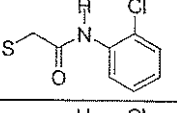
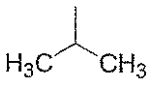
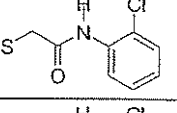
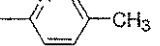
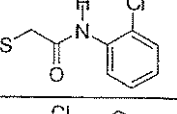
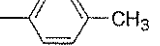
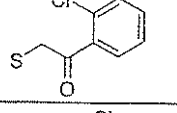
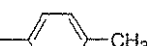
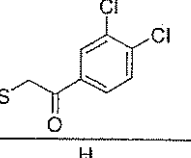
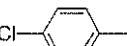
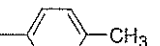
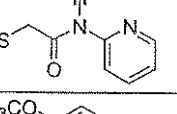
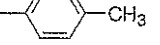
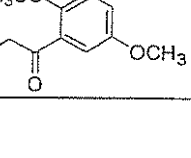
10

20

30

40

【表 5 3】

C58			
C59			
C60			
C61			
C62			
C63			
C64			
C65			
C66			
C67			
C68			
C69			
C70			
C71			

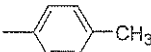
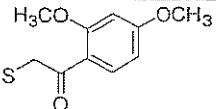
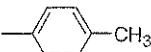
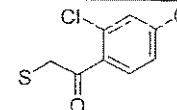
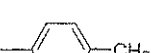
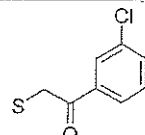
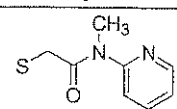
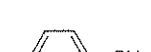
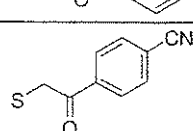
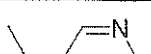
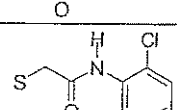
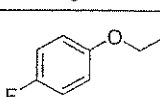
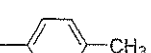
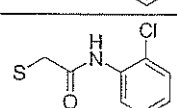
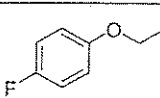
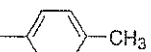
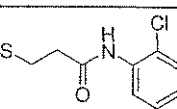
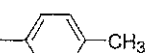
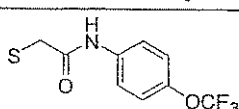
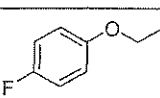
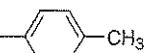
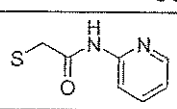
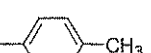
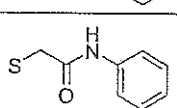
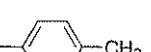
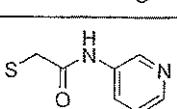
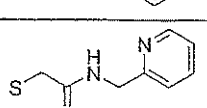
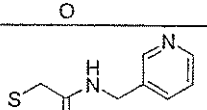
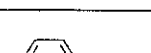
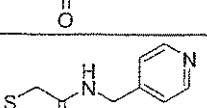
10

20

30

40

【表 5 4】

C72			
C73			
C74			
C75			
C76			
C77			
C78			
C79			
C80			
C81			
C82			
C83			
C84			
C85			
C86			

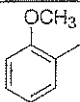
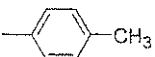
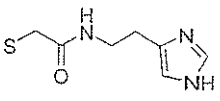
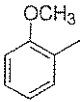
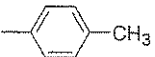
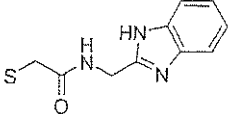
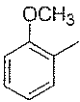
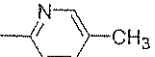
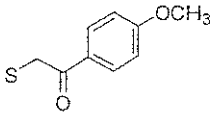
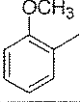
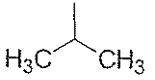
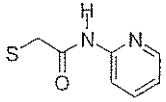
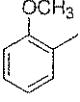
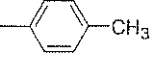
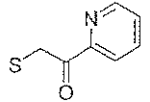
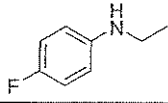
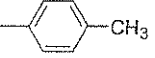
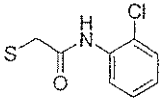
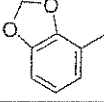
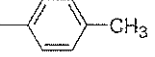
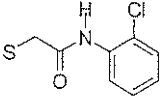
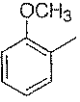
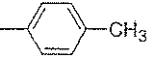
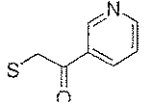
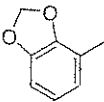
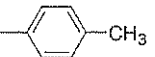
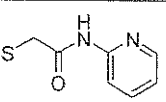
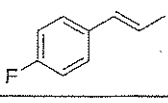
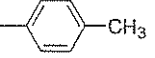
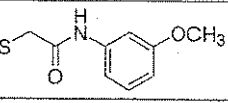
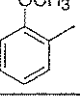
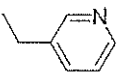
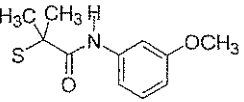
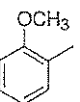
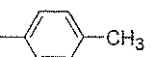
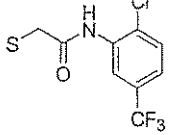
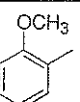
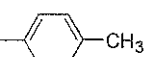
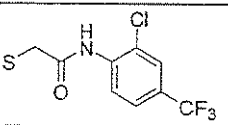
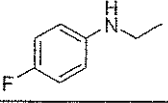
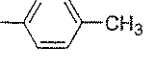
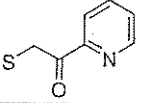
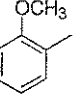
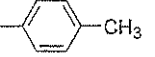
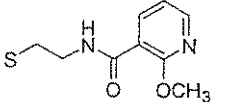
10

20

30

40

【表 5 5】

C87			
C88			
C89			
C90			
C91			
C92			
C93			
C94			
C95			
C96			
C97			
C98			
C99			
C100			
C101			

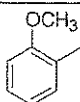
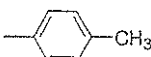
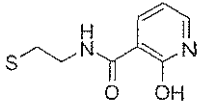
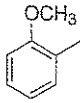
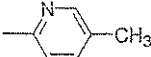
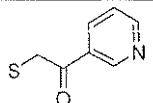
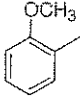
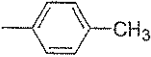
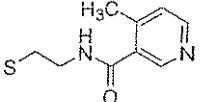
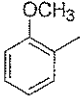
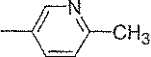
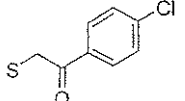
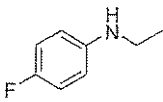
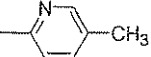
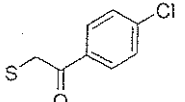
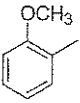
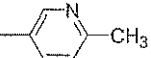
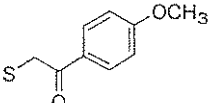
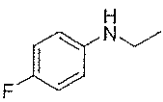
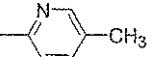
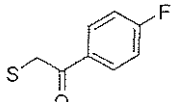
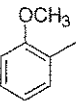
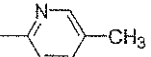
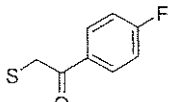
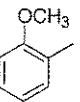
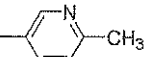
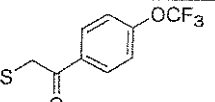
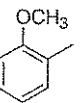
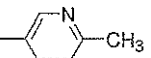
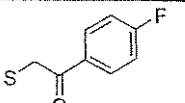
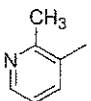
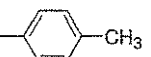
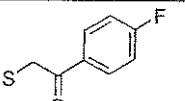
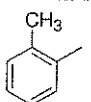
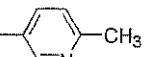
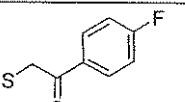
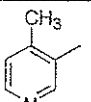
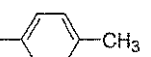
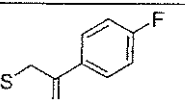
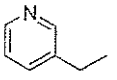
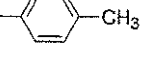
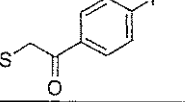
10

20

30

40

【表 5 6】

C102			
C103			
C104			
C105			
C106			
C107			
C108			
C109			
C110			
C111			
C112			
C113			
C114			
C115			

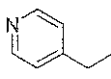
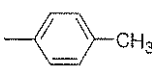
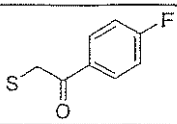
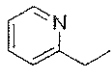
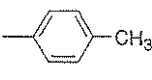
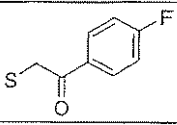
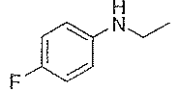
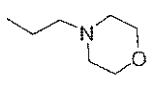
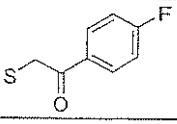
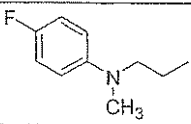
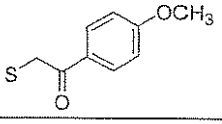
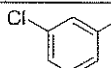
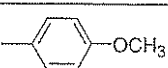
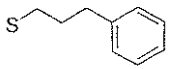
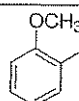
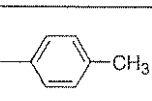
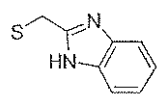
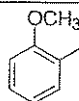
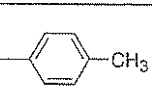
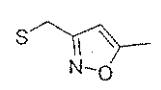
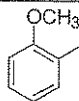
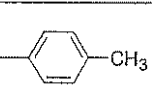
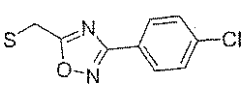
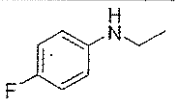
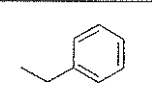
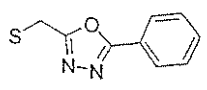
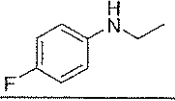
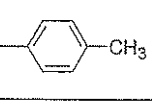
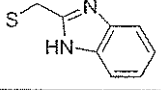
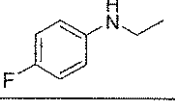
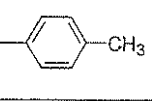
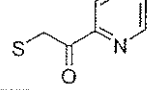
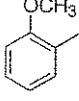
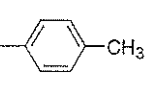
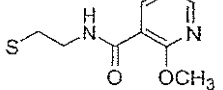
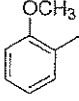
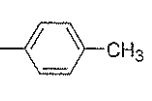
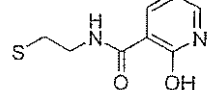
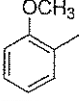
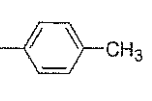
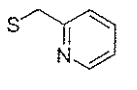
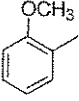
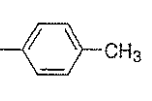
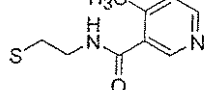
10

20

30

40

【表 5 7】

C116			
C117			
C118			
C119		CH ₃	
C120			
C121			
C122			
C123			
C124			
C125			
C126			
C127			
C128			
C129			
C130			

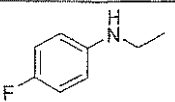
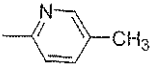
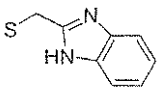
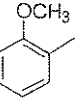
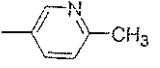
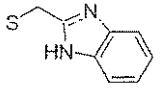
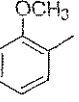
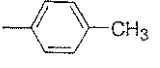
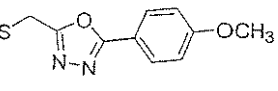
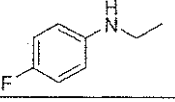
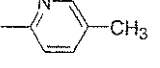
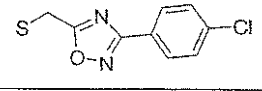
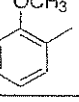
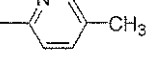
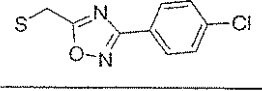
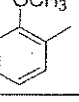
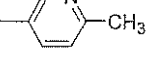
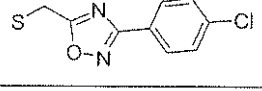
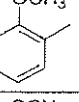
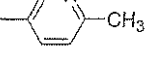
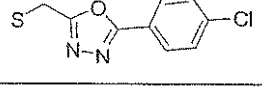
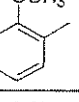
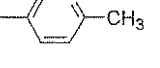
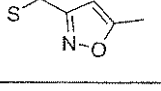
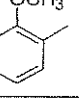
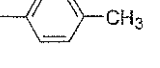
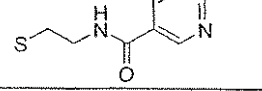
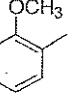
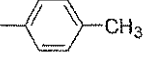
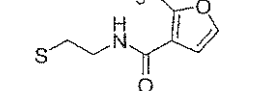
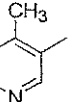
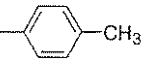
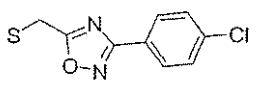
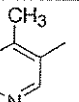
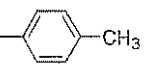
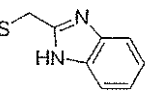
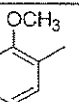
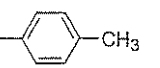
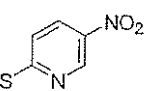
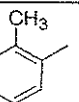
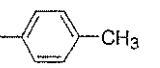
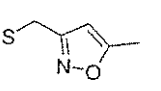
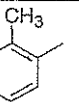
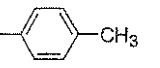
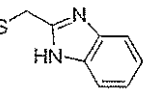
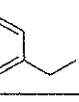
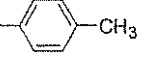
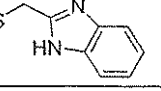
10

20

30

40

【表 5 8】

C131			
C132			
C133			
C134			
C135			
C136			
C137			
C138			
C139			
C140			
C141			
C142			
C143			
C144			
C145			
C146			

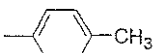
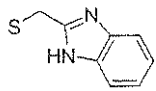
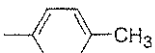
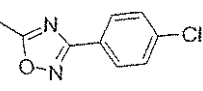
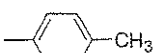
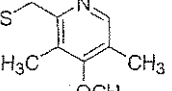
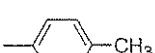
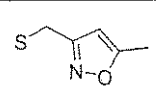
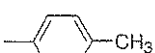
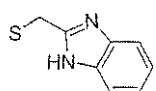
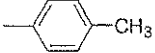
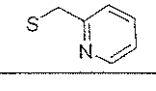
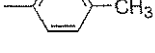
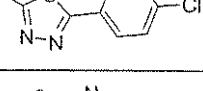
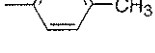
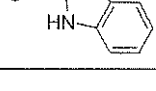
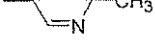
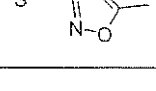
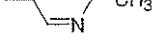
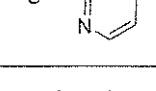
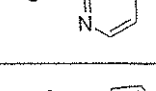
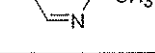
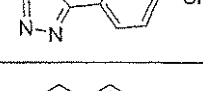
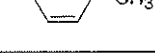
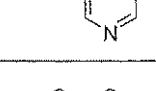
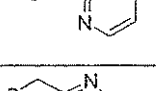
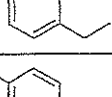
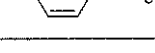
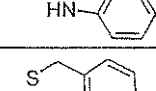
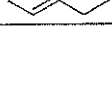
10

20

30

40

【表 5 9】

C147			
C148			
C149			
C150			
C151			
C152			
C153			
C154			
C155			
C156			
C157			
C158			
C159			
C160			
C161			
C162			

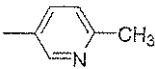
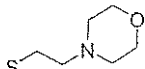
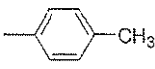
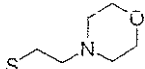
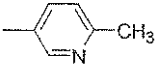
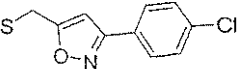
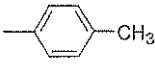
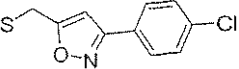
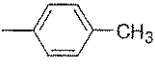
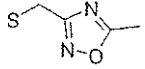
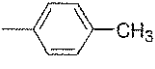
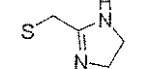
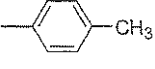
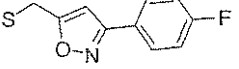
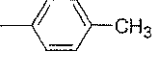
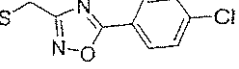
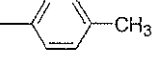
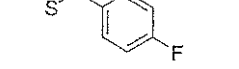
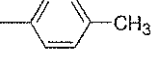
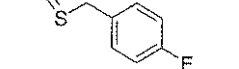
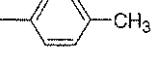
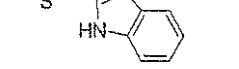
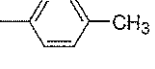
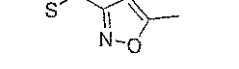
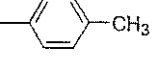
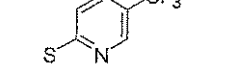
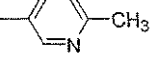
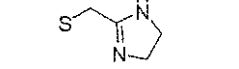
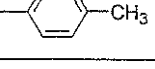
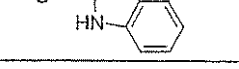
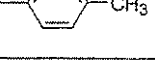
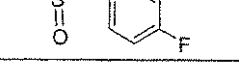
10

20

30

40

【表 6 0】

C163			
C164			
C165			
C166			
C167			
C168			
C169			
C170			
C171			
C172			
C173			
C174			
C175			
C176			
C177			
C178			

10

20

30

40

【表 6 1】

C179			
C180			
C181			
C182			
C183		CH ₃	
C184			
C185		CH ₃	
C186			
C187			
C188			
C189			
C190		CH ₃	
C191			
C192			
C193			
C194			

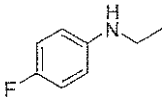
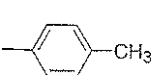
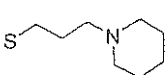
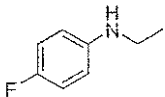
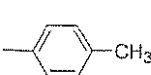
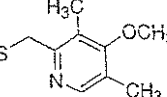
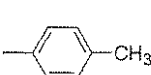
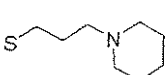
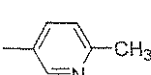
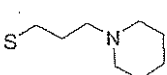
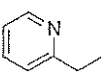
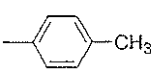
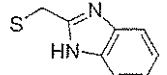
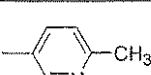
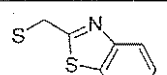
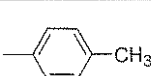
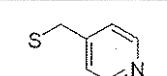
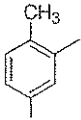
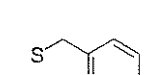
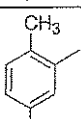
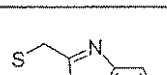
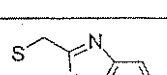
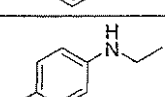
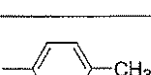
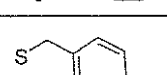
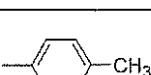
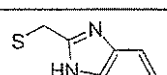
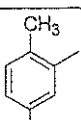
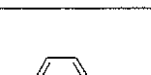
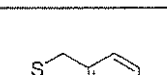
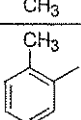
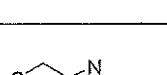
10

20

30

40

【表 6 2】

C195			
C196			
C197			
C198			
C199			
C200			
C201			
C202			
C203			
C204			
C205			
C206			
C207			
C208			

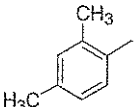
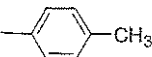
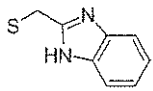
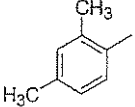
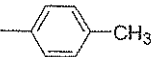
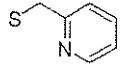
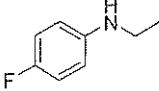
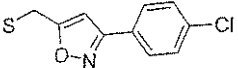
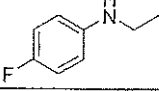
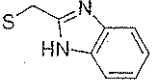
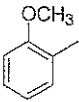
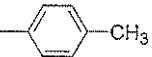
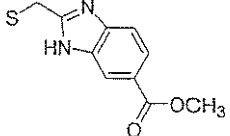
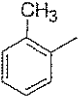
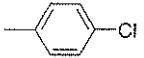
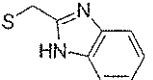
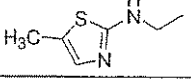
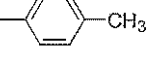
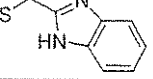
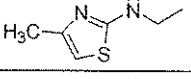
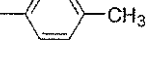
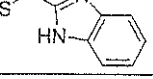
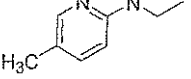
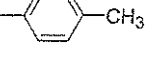
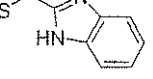
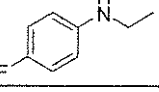
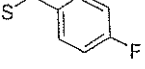
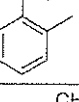
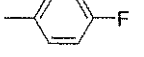
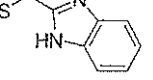
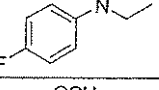
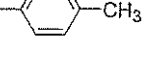
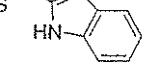
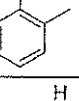
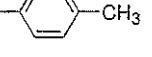
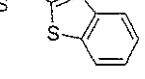
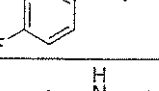
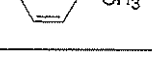
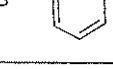
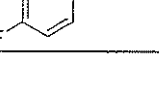
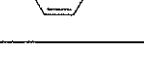
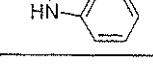
10

20

30

40

【表 6 3】

C209			
C210			
C211		CH ₃	
C212			
C213			
C214			
C215			
C216			
C217			
C218		CH ₃	
C219			
C220			
C221			
C222			
C223			

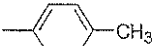
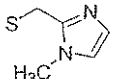
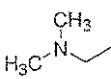
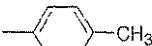
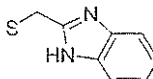
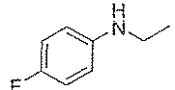
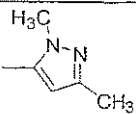
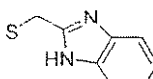
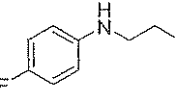
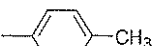
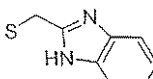
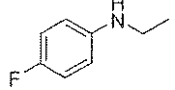
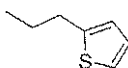
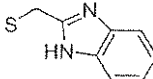
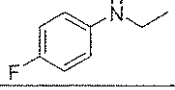
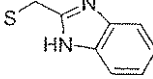
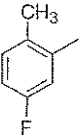
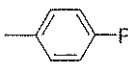
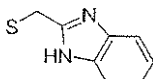
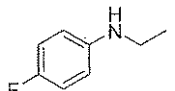
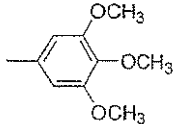
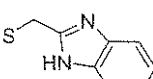
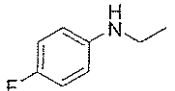
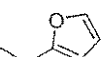
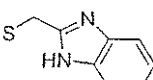
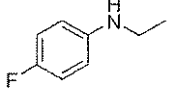
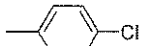
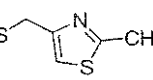
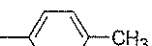
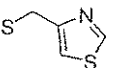
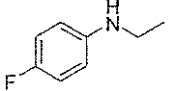
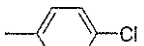
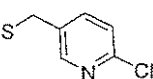
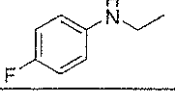
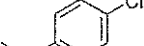
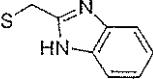
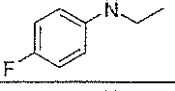
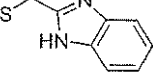
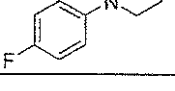
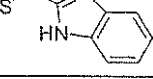
10

20

30

40

【表 6 4】

C224			
C225			
C226			
C227			
C228			
C229			
C230			
C231			
C232			
C233			
C234			
C235			
C236			
C237			
C238			

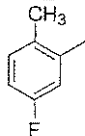
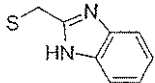
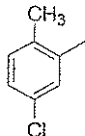
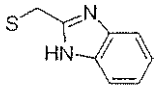
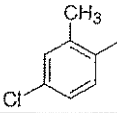
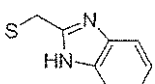
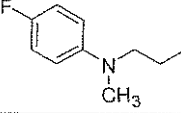
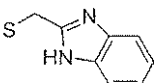
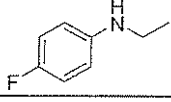
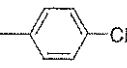
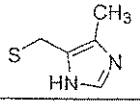
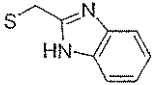
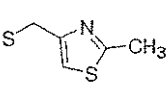
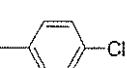
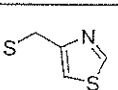
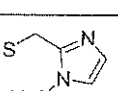
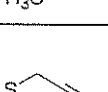
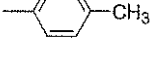
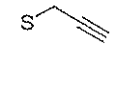
10

20

30

40

【表 6 5】

C239		CH ₃	
C240		CH ₃	
C241		CH ₃	
C242		CH ₃	
C243			
C244			
C245			
C246			
C247			
C248			
C249			
C250			

10

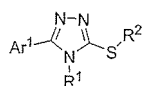
20

30

40

【表 6 6】

表 C1B



Cpd no.	Ar ¹	R ¹	R ²
C251			
C252			
C253			
C254			
C255			
C256			
C257			
C258			
C259			
C260			
C261			
C262			
C263			
C264			
C265			

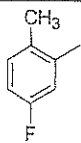
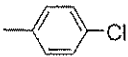
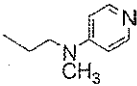
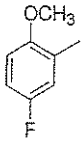
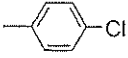
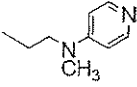
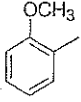
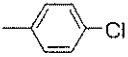
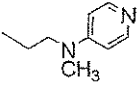
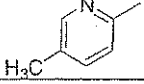
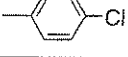
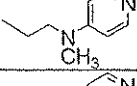
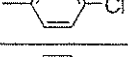
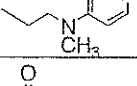
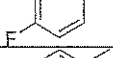
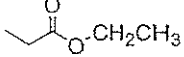
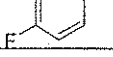
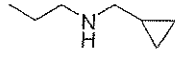
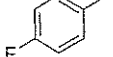
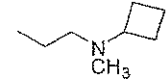
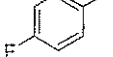
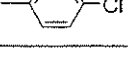
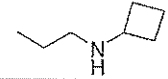
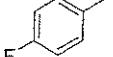
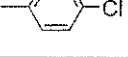
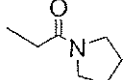
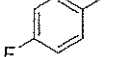
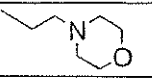
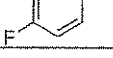
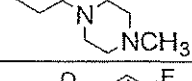
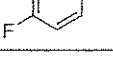
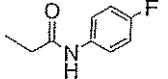
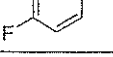
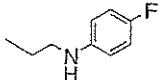
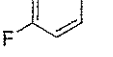
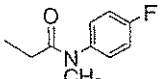
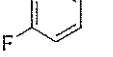
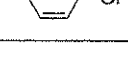
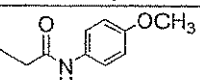
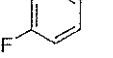
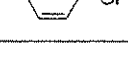
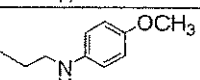
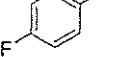
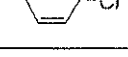
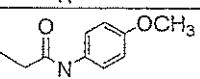
10

20

30

【 0 1 1 7 】

【表 6 7】

C266			
C267			
C268			
C269			
C270			
C271			
C272			
C273			
C274			
C275			
C276			
C277			
C278			
C279			
C280			
C281			
C282			
C283			

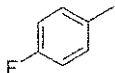
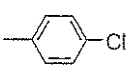
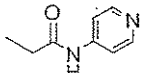
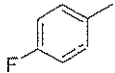
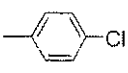
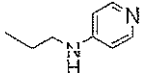
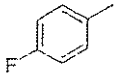
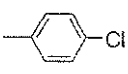
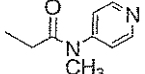
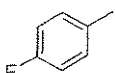
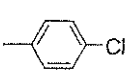
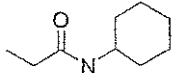
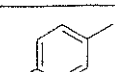
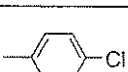
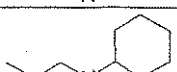
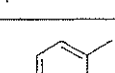
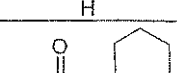
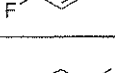
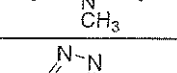
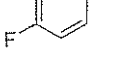
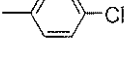
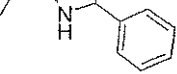
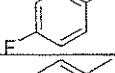
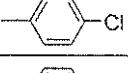
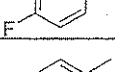
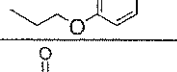
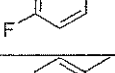
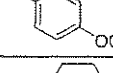
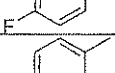
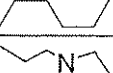
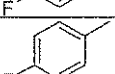
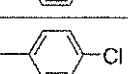
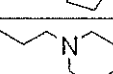
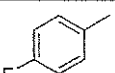
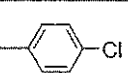
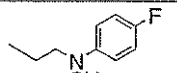
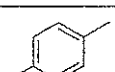
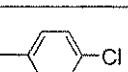
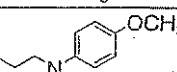
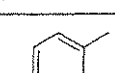
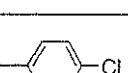
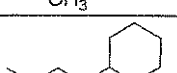
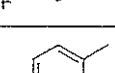
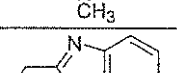
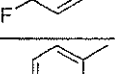
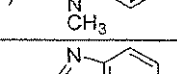
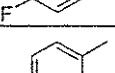
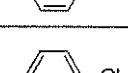
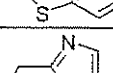
10

20

30

40

【表 6 8】

C284			
C285			
C286			
C287			
C288			
C289			
C290			
C291			
C292			
C293			
C294			
C295			
C296			
C297			
C298			
C299			
C300			
C301			
C302			

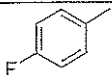
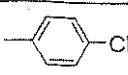
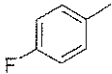
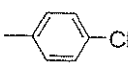
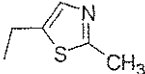
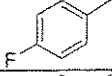
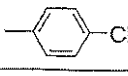
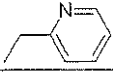
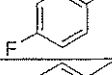
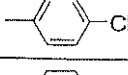
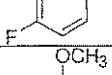
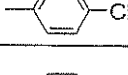
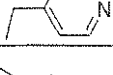
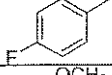
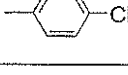
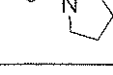
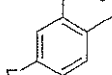
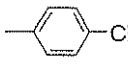
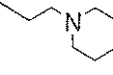
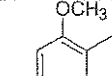
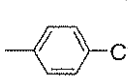
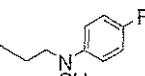
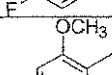
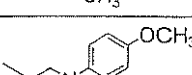
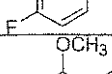
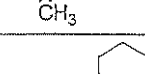
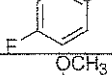
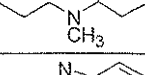
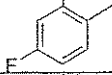
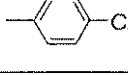
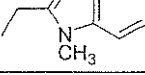
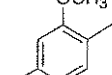
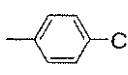
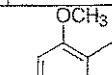
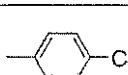
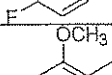
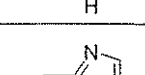
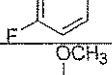
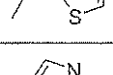
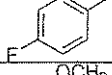
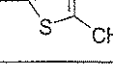
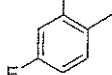
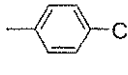
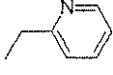
10

20

30

40

【表 6 9】

C303			
C304			
C305			
C306			
C307			
C308			
C309			
C310			
C311			
C312			
C313			
C314			
C315			
C316			
C317			
C318			
C319			
C320			

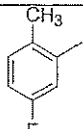
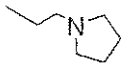
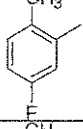
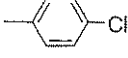
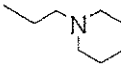
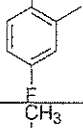
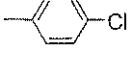
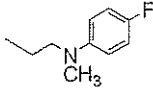
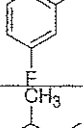
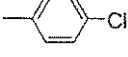
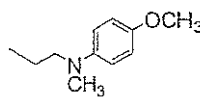
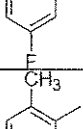
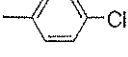
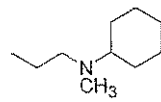
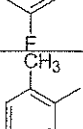
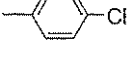
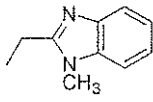
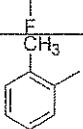
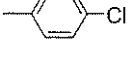
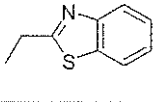
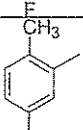
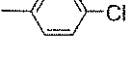
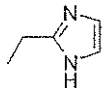
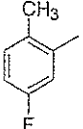
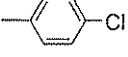
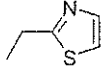
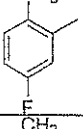
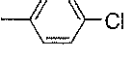
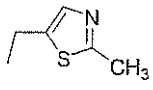
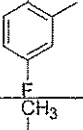
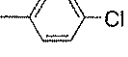
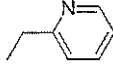
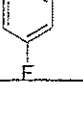
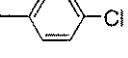
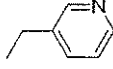
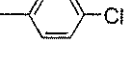
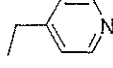
10

20

30

40

【表 7 0】

C321			
C322			
C323			
C324			
C325			
C326			
C327			
C328			
C329			
C330			
C331			
C332			
C333			

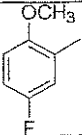
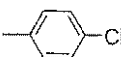
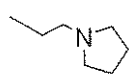
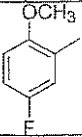
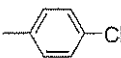
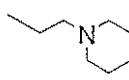
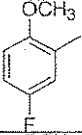
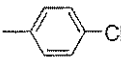
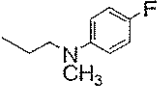
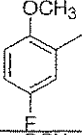
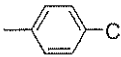
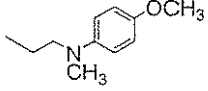
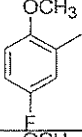
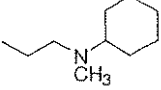
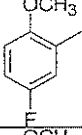
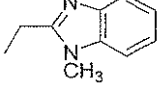
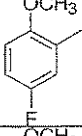
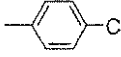
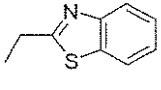
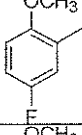
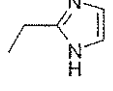
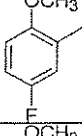
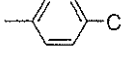
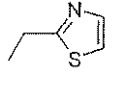
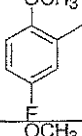
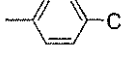
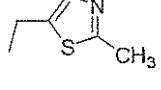
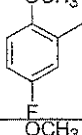
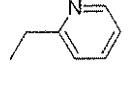
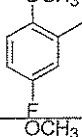
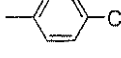
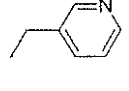
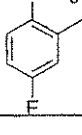
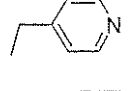
10

20

30

40

【表 7 1】

C334			
C335			
C336			
C337			
C338			
C339			
C340			
C341			
C342			
C343			
C344			
C345			
C346			

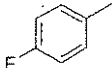
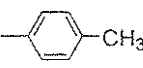
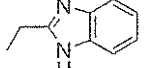
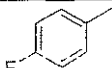
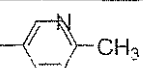
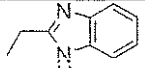
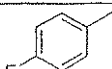
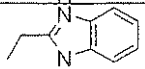
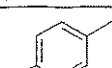
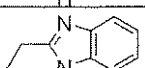
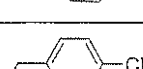
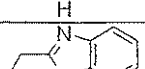
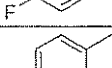
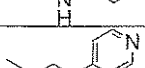
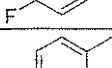
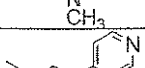
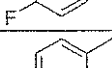
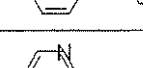
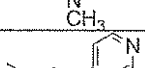
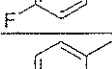
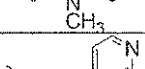
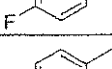
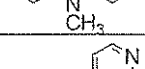
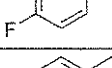
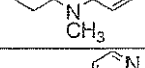
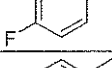
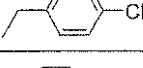
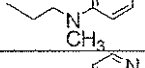
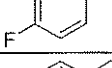
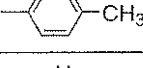
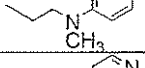
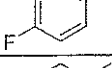
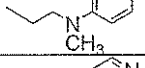
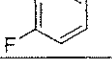
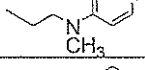
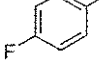
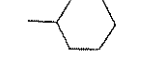
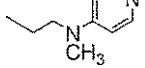
10

20

30

40

【表 7 2】

C347			
C348			
C349		CH ₃	
C350			
C351			
C352			
C353			
C354			
C355		CH ₃	
C356			
C357			
C358			
C359			
C360		CH ₃	
C361			
C362			

10

20

30

【表 7 3】



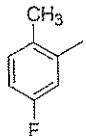
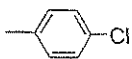
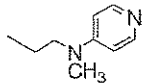
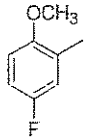
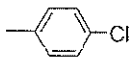
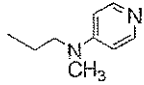
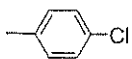
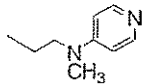
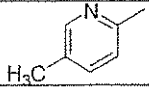
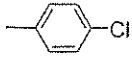
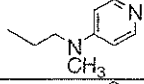
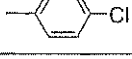
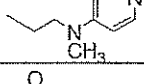
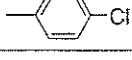
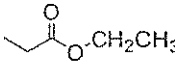
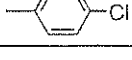
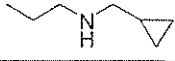
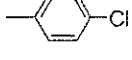
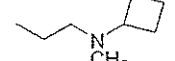
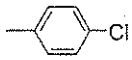
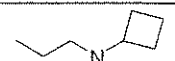
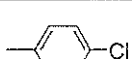
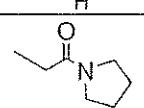
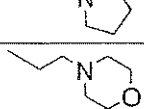
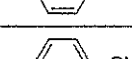
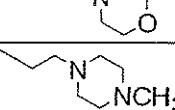
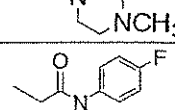
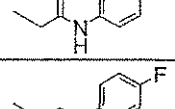
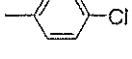
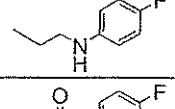
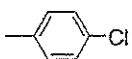
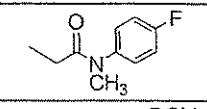
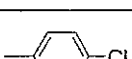
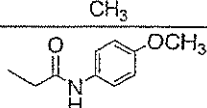
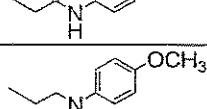
Cpd no.	Ar¹	R¹	R²
C363			
C364			
C365			
C366			
C367			
C368			
C369			
C370			
C371			
C372			
C373			
C374			
C375			
C376			
C377			
C378			

10

20

30

【表 7 4】

C379			
C380			
C381			
C382			
C383			
C384			
C385			
C386			
C387			
C388			
C389			
C390			
C391			
C392			
C393			
C394			
C395			
C396			

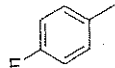
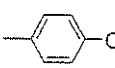
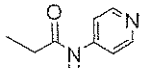
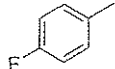
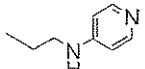
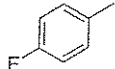
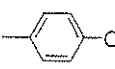
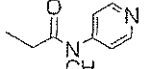
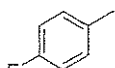
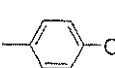
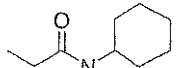
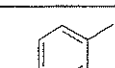
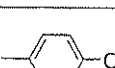
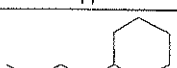
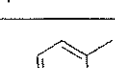
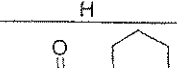
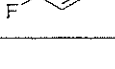
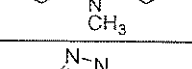
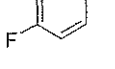
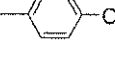
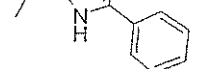
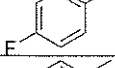
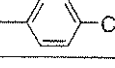
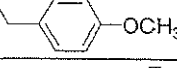
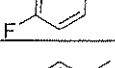
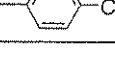
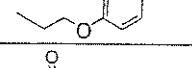
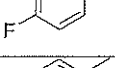
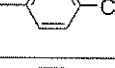
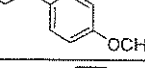
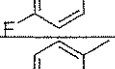
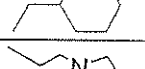
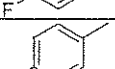
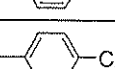
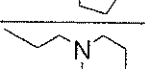
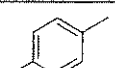
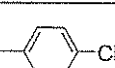
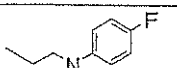
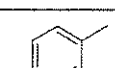
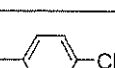
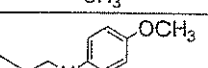
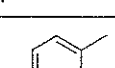
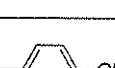
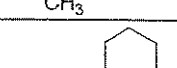
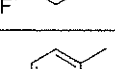
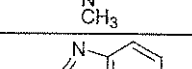
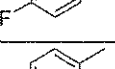
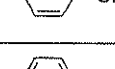
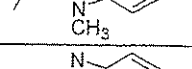
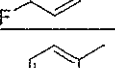
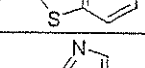
10

20

30

40

【表 7 5】

C397			
C398			
C399			
C400			
C401			
C402			
C403			
C404			
C405			
C406			
C407			
C408			
C409			
C410			
C411			
C412			
C413			
C414			
C415			

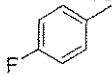
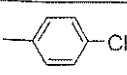
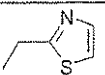
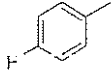
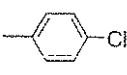
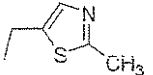
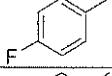
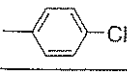
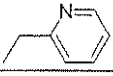
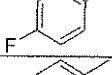
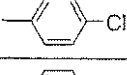
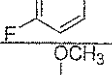
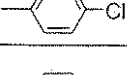
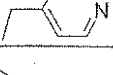
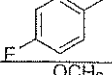
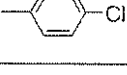
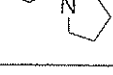
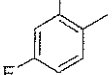
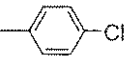
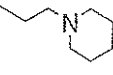
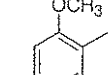
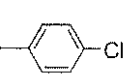
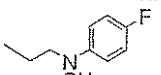
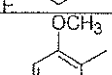
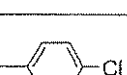
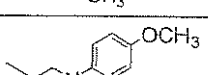
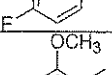
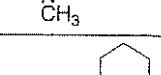
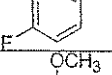
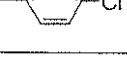
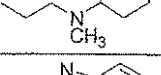
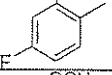
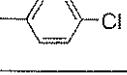
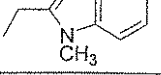
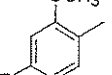
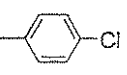
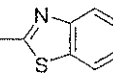
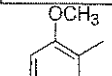
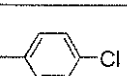
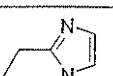
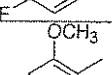
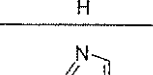
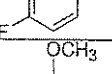
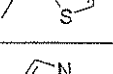
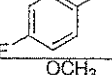
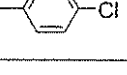
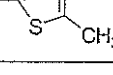
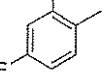
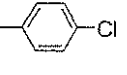
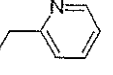
10

20

30

40

【表 7 6】

C416			
C417			
C418			
C419			
C420			
C421			
C422			
C423			
C424			
C425			
C426			
C427			
C428			
C429			
C430			
C431			
C432			
C433			

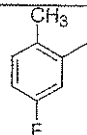
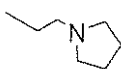
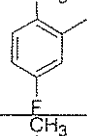
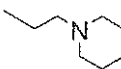
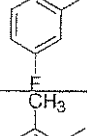
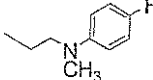
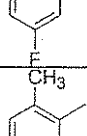
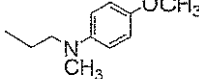
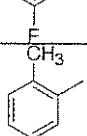
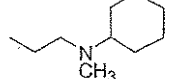
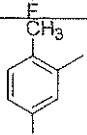
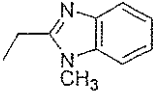
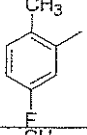
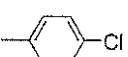
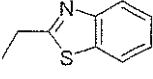
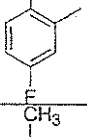
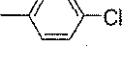
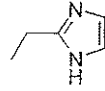
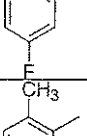
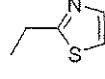
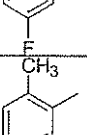
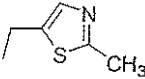
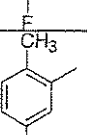
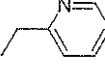
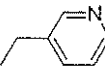
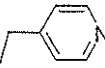
10

20

30

40

【表 7 7】

C434			
C435			
C436			
C437			
C438			
C439			
C440			
C441			
C442			
C443			
C444			
C445			
C446			

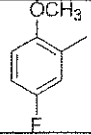
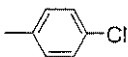
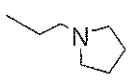
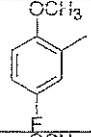
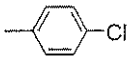
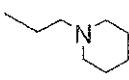
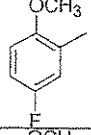
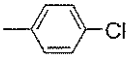
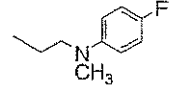
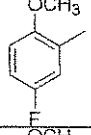
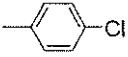
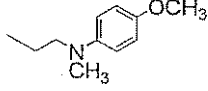
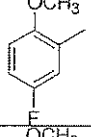
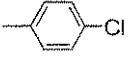
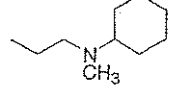
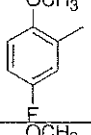
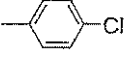
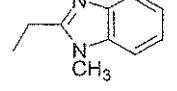
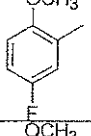
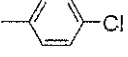
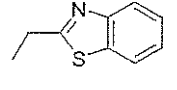
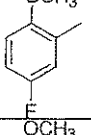
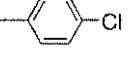
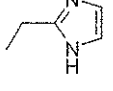
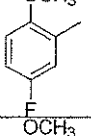
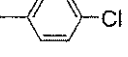
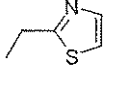
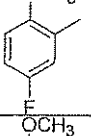
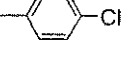
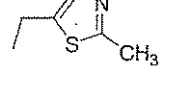
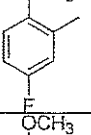
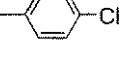
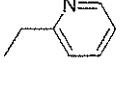
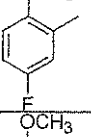
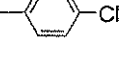
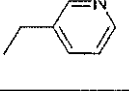
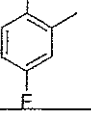
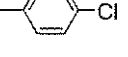
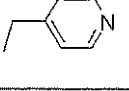
10

20

30

40

【表 7 8】

C447			
C448			
C449			
C450			
C451			
C452			
C453			
C454			
C455			
C456			
C457			
C458			
C459			

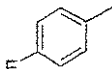
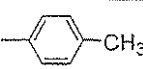
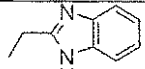
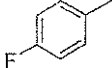
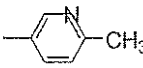
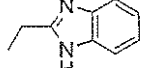
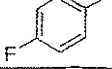
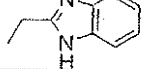
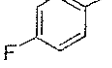
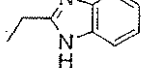
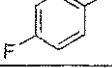
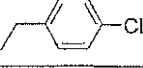
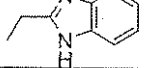
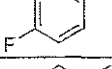
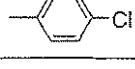
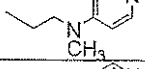
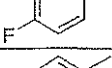
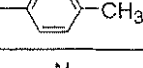
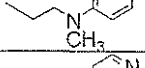
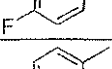
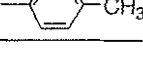
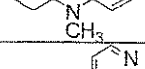
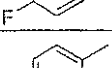
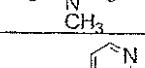
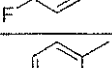
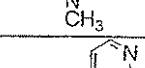
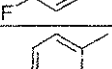
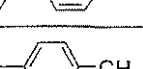
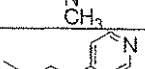
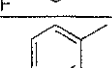
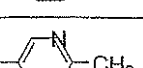
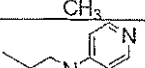
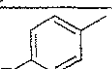
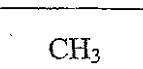
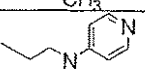
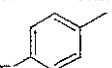
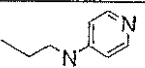
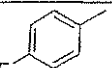
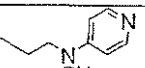
10

20

30

40

【表 7 9】

C460			
C461			
C462		CH ₃	
C463			
C464			
C465			
C466			
C467			
C468		CH ₃	
C469			
C470			
C471			
C472			
C473		CH ₃	
C474			
C475			

10

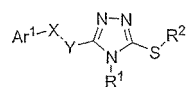
20

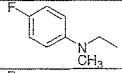
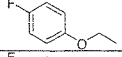
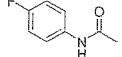
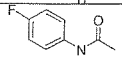
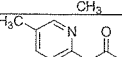
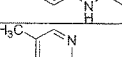
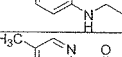
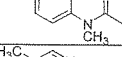
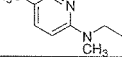
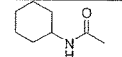
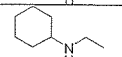
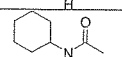
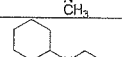
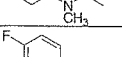
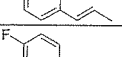
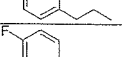
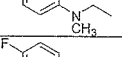
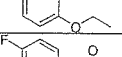
30

【0130】

【表 80】

表 C1D



Cpd no.	Ar ¹ -X-Y	R ¹	R ²
C476			
C477			
C478			
C479			
C480			
C481			
C482			
C483			
C484			
C485			
C486			
C487			
C488			
C489			
C490			
C491			
C492			
C493			

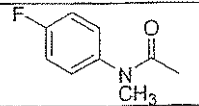
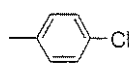
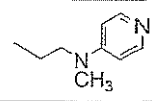
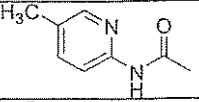
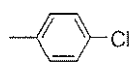
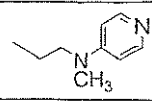
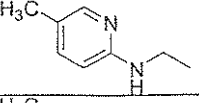
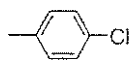
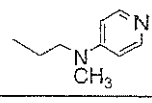
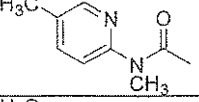
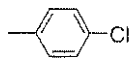
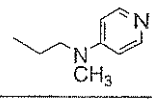
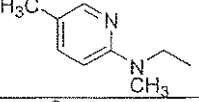
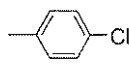
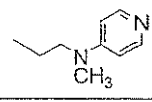
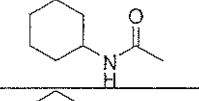
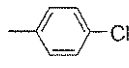
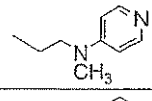
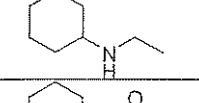
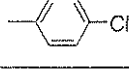
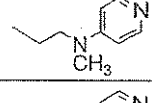
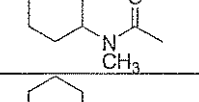
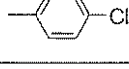
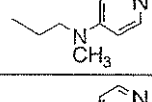
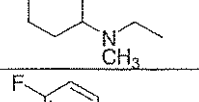
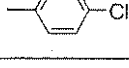
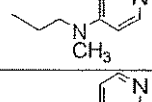
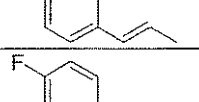
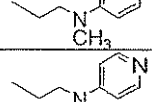
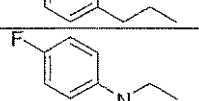
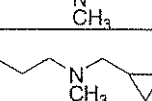
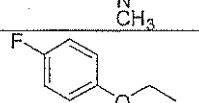
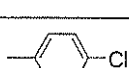
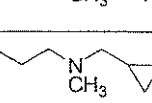
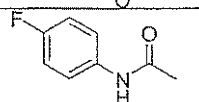
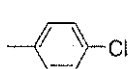
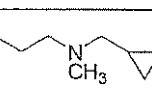
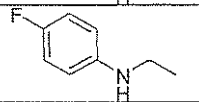
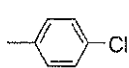
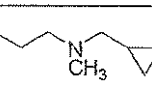
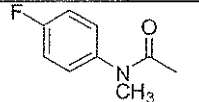
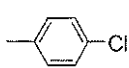
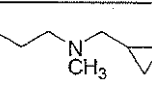
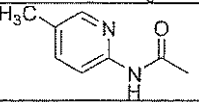
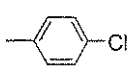
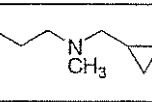
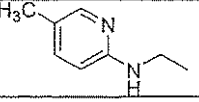
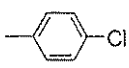
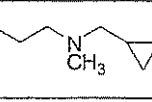
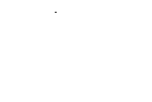
10

20

30

【0131】

【表 8 1】

C494			
C495			
C496			
C497			
C498			
C499			
C500			
C501			
C502			
C503			
C504			
C505			
C506			
C507			
C508			
C509			
C510			
C511			

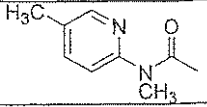
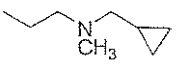
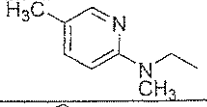
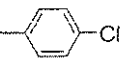
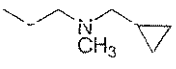
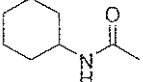
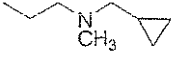
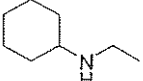
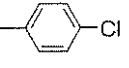
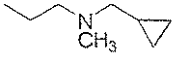
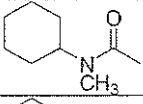
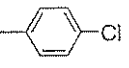
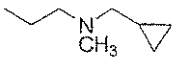
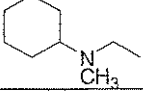
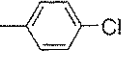
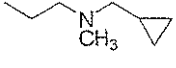
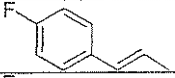
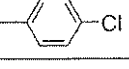
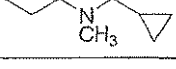
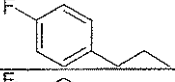
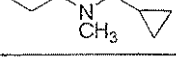
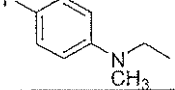
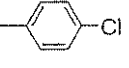
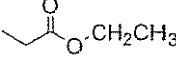
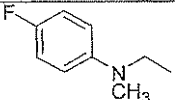
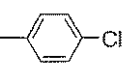
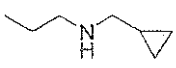
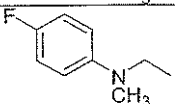
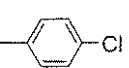
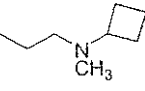
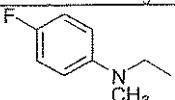
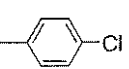
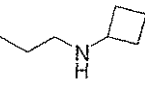
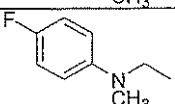
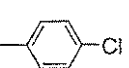
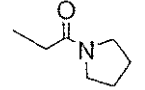
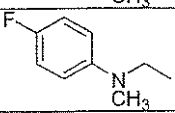
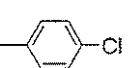
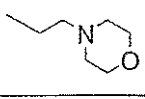
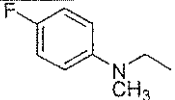
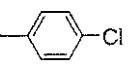
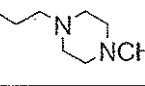
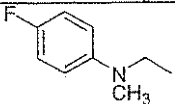
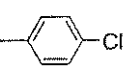
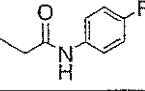
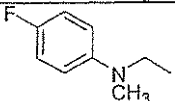
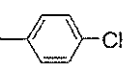
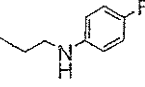
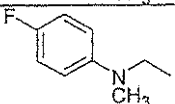
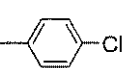
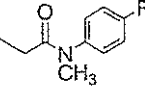
10

20

30

40

【表 8 2】

C512			
C513			
C514			
C515			
C516			
C517			
C518			
C519			
C520			
C521			
C522			
C523			
C524			
C525			
C526			
C527			
C528			
C529			

10

20

30

40

【表 8 3】

C530			
C531			
C532			
C533			
C534			
C535			
C536			
C537			
C538			
C539			
C540			
C541			
C542			
C543			
C544			
C545			

10

20

30

40

【表 8 4】

C546			
C547			
C548			
C549			
C550			
C551			
C552			
C553			
C554			
C555			
C556			
C557			
C558			
C559			
C560			
C561			
C562			

10

20

30

40

【表 8 5】

C563			
C564			
C565			
C566			
C567			
C568			
C569			
C570			
C571			
C572			
C573			
C574			
C575			
C576			
C577			
C578			
C579			
C580			

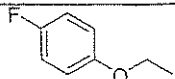
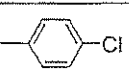
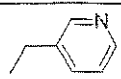
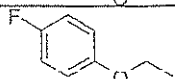
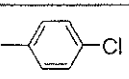
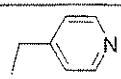
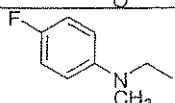
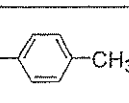
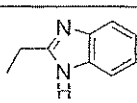
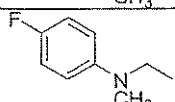
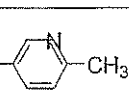
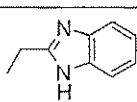
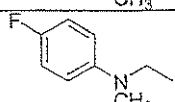
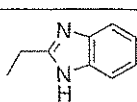
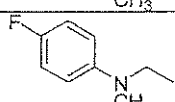
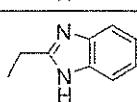
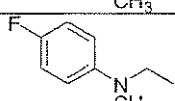
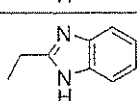
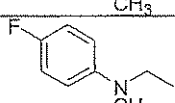
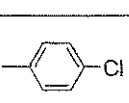
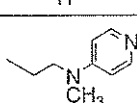
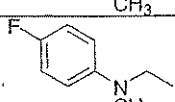
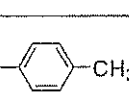
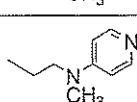
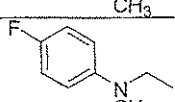
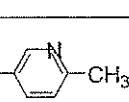
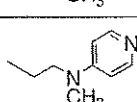
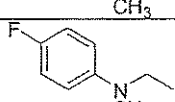
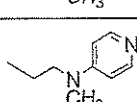
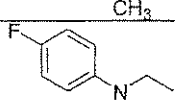
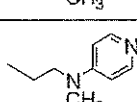
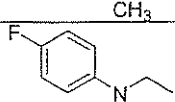
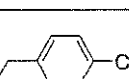
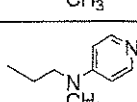
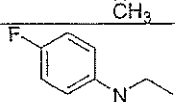
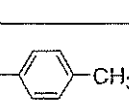
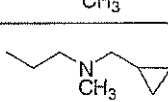
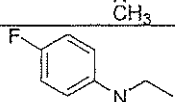
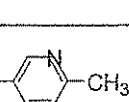
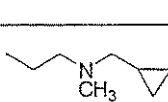
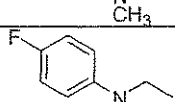
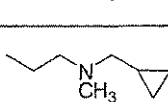
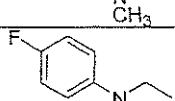
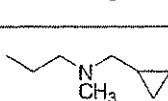
10

20

30

40

【表 8 6】

C581			
C582			
C583			
C584			
C585		CH ₃	
C586			
C587			
C588			
C589			
C590			
C591		CH ₃	
C592			
C593			
C594			
C595			
C596		CH ₃	
C597			

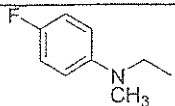
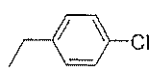
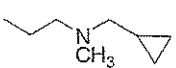
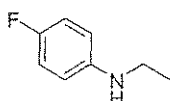
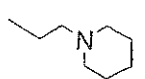
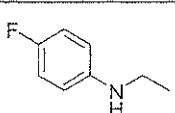
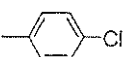
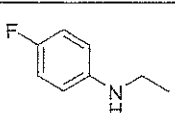
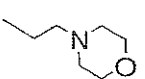
10

20

30

40

【表 8 7】

C598			
C599		CH ₃	
C600			
C601		CH ₃	

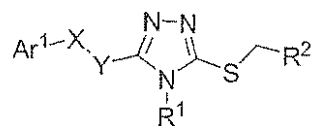
10

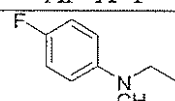
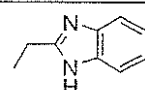
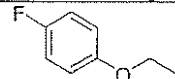
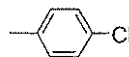
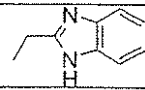
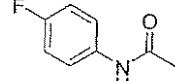
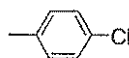
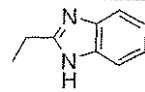
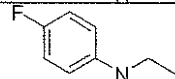
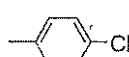
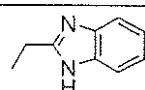
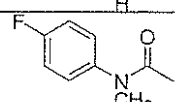
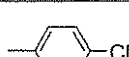
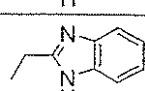
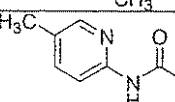
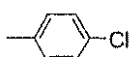
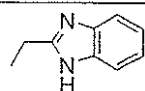
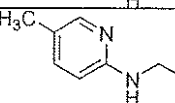
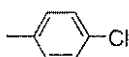
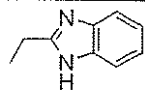
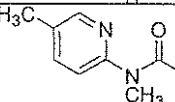
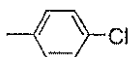
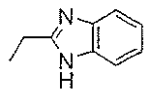
【 0 1 3 8 】

【表 8 8】

表 C1E

20



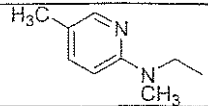
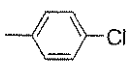
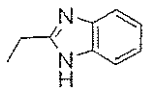
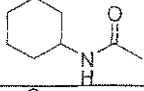
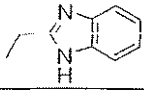
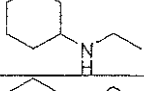
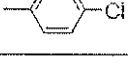
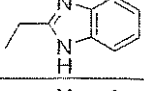
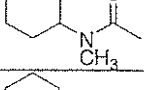
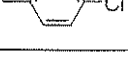
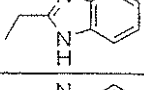
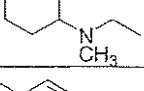
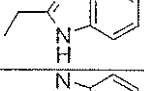
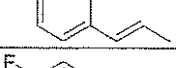
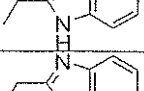
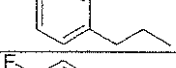
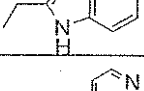
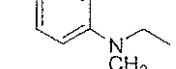
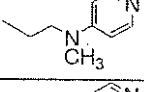
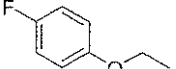
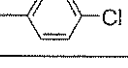
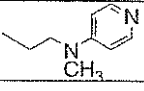
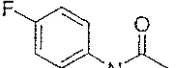
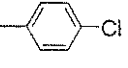
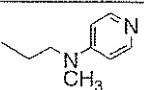
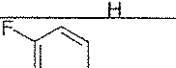
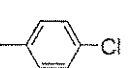
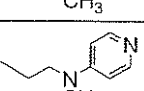
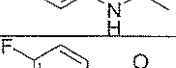
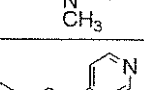
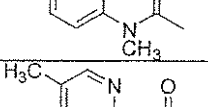
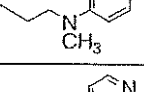
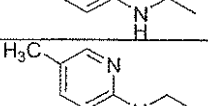
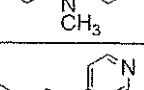
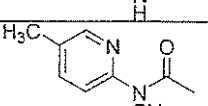
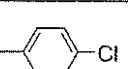
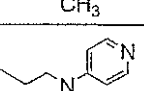
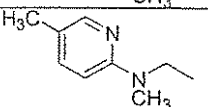
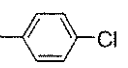
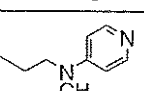
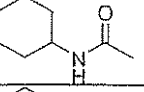
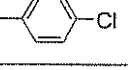
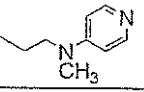
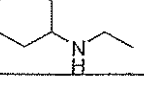
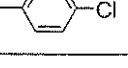
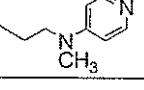
Cpd no.	Ar ¹ -X-Y	R ¹	R ²
C602			
C603			
C604			
C605			
C606			
C607			
C608			
C609			

30

40

【 0 1 3 9 】

【表 8 9】

C610			
C611			
C612			
C613			
C614			
C615			
C616			
C617			
C618			
C619			
C620			
C621			
C622			
C623			
C624			
C625			
C626			
C627			

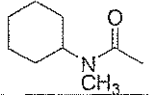
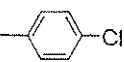
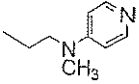
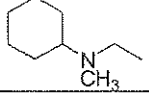
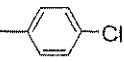
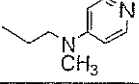
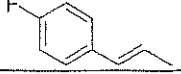
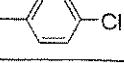
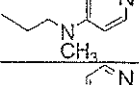
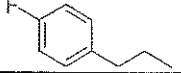
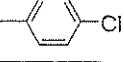
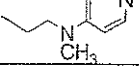
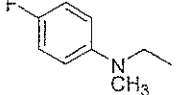
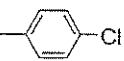
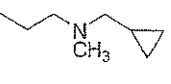
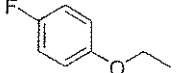
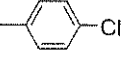
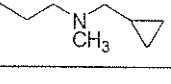
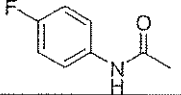
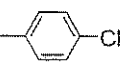
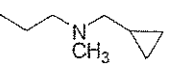
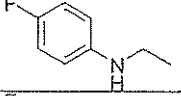
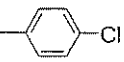
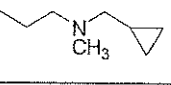
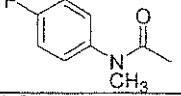
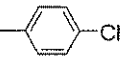
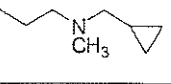
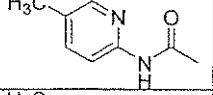
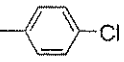
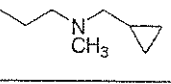
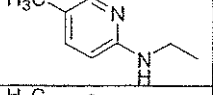
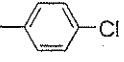
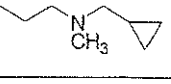
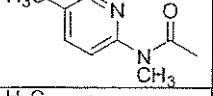
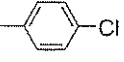
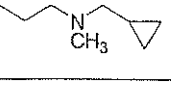
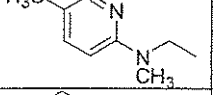
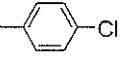
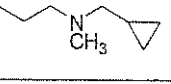
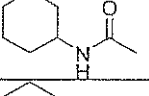
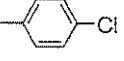
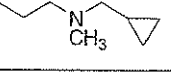
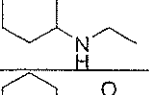
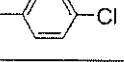
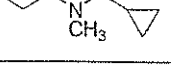
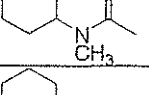
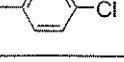
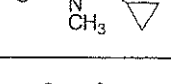
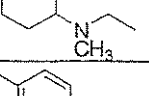
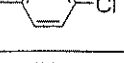
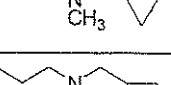
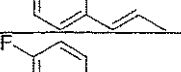
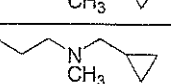
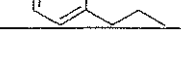
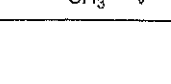
10

20

30

40

【表 9 0】

C628			
C629			
C630			
C631			
C632			
C633			
C634			
C635			
C636			
C637			
C638			
C639			
C640			
C641			
C642			
C643			
C644			
C645			
C646			

10

20

30

40

【表 9 1】

C647			
C648			
C649			
C650			
C651			
C652			
C653			
C654			
C655			
C656			
C657			
C658			
C659			
C660			
C661			
C662			
C663			

10

20

30

40

【表 9 2】

C664			
C665			
C666			
C667			
C668			
C669			
C670			
C671			
C672			
C673			
C674			
C675			
C676			
C677			
C678			
C679			

10

20

30

40

【表 9 3】

C680			
C681			
C682			
C683			
C684			
C685			
C686			
C687			
C688			
C689			
C690			
C691			
C692			
C693			
C694			
C695			
C696			

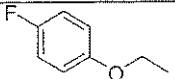
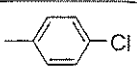
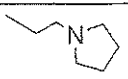
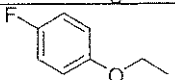
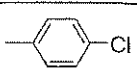
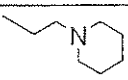
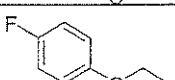
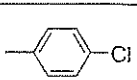
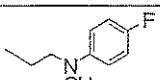
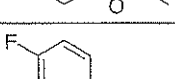
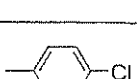
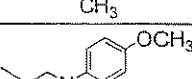
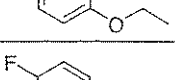
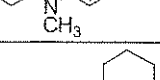
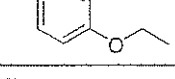
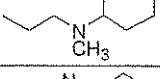
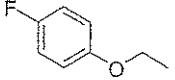
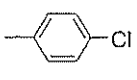
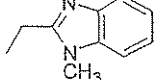
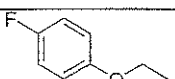
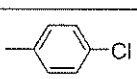
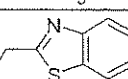
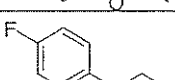
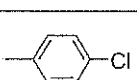
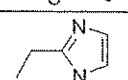
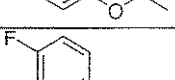
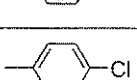
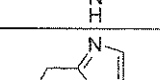
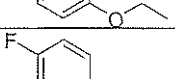
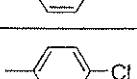
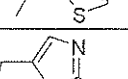
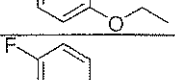
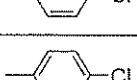
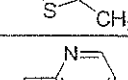
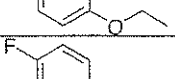
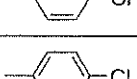
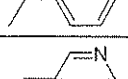
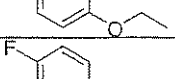
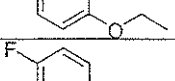
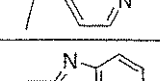
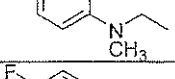
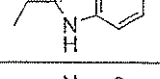
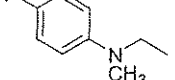
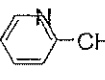
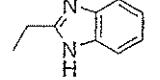
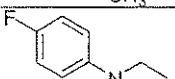
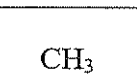
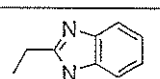
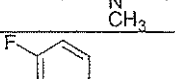
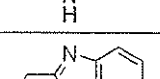
10

20

30

40

【表 9 4】

C697			
C698			
C699			
C700			
C701			
C702			
C703			
C704			
C705			
C706			
C707			
C708			
C709			
C710			
C711			
C712		CH_3	
C713			
C714			
C715			

10

20

30

40

【表 9 5】

C716			
C717			
C718		CH ₃	
C719			
C720			
C721			
C722			
C723		CH ₃	
C724			
C725			

10

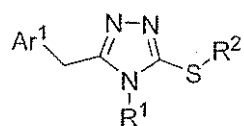
20

30

【 0 1 4 6 】

【表 9 6】

表 C1F



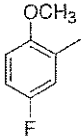
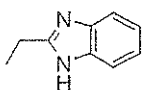
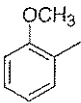
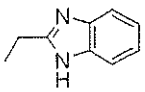
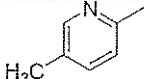
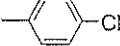
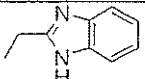
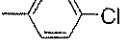
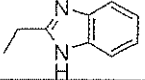
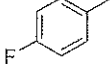
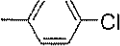
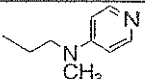
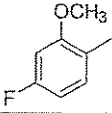
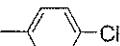
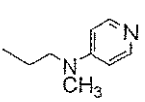
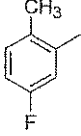
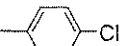
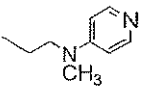
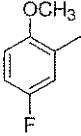
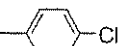
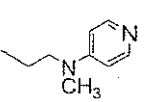
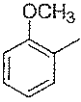
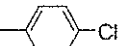
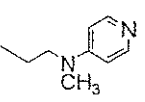
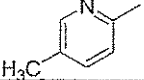
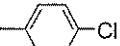
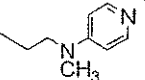
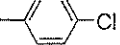
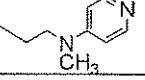
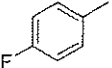
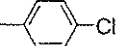
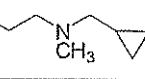
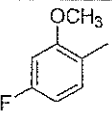
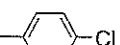
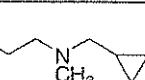
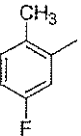
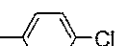
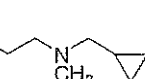
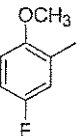
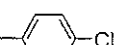
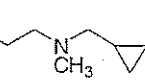
Cpd. No.	Ar ¹	R ¹	R ²
C726			
C727			
C728			

40

【 0 1 4 7 】

50

【表 9 7】

C729			
C730			
C731			
C732			
C733			
C734			
C735			
C736			
C737			
C738			
C739			
C740			
C741			
C742			
C743			

10

20

30

40

【表 9 8】

C744			
C745			
C746			
C747			
C748			
C749			
C750			
C751			
C752			
C753			
C754			
C755			
C756			
C757			
C758			
C759			
C760			
C761			
C762			
C763			

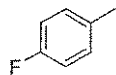
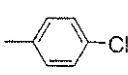
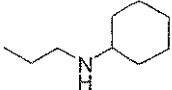
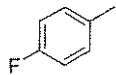
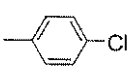
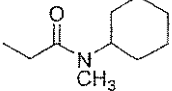
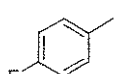
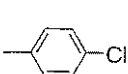
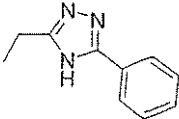
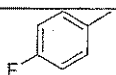
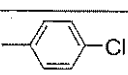
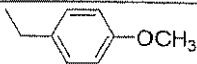
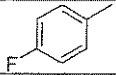
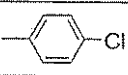
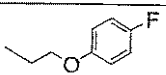
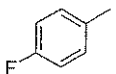
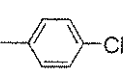
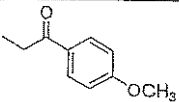
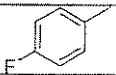
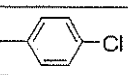
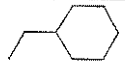
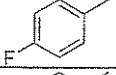
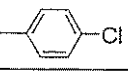
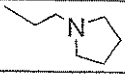
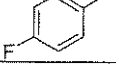
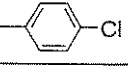
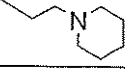
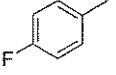
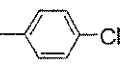
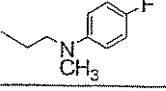
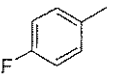
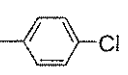
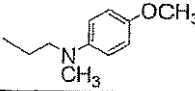
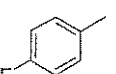
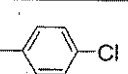
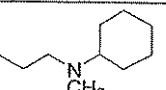
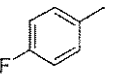
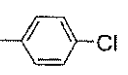
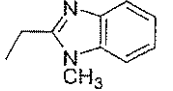
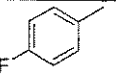
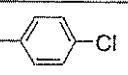
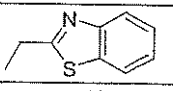
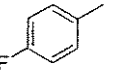
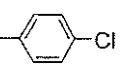
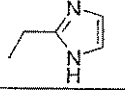
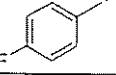
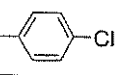
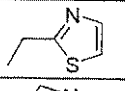
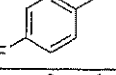
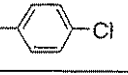
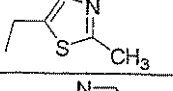
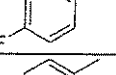
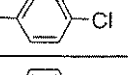
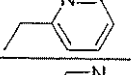
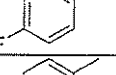
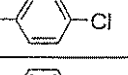
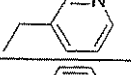
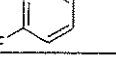
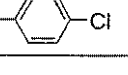
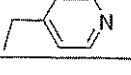
10

20

30

40

【表 9 9】

C764			
C765			
C766			
C767			
C768			
C769			
C770			
C771			
C772			
C773			
C774			
C775			
C776			
C777			
C778			
C779			
C780			
C781			
C782			
C783			

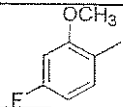
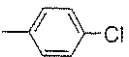
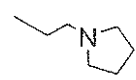
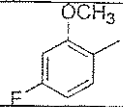
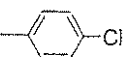
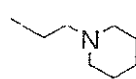
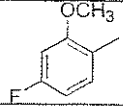
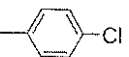
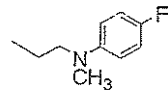
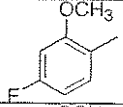
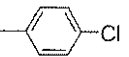
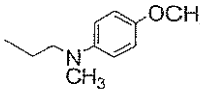
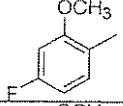
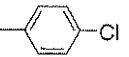
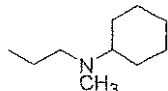
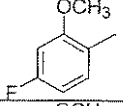
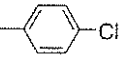
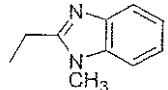
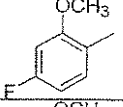
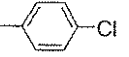
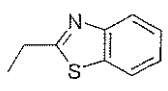
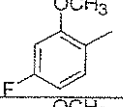
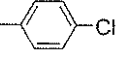
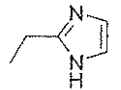
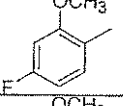
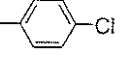
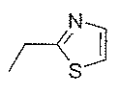
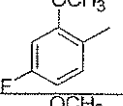
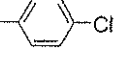
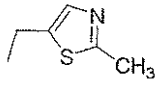
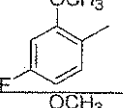
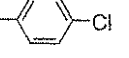
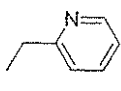
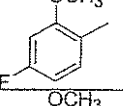
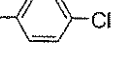
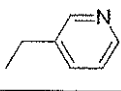
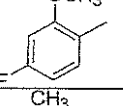
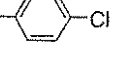
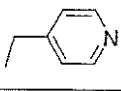
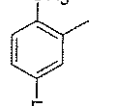
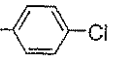
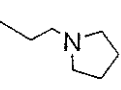
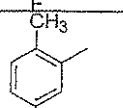
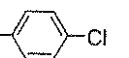
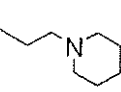
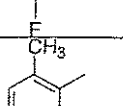
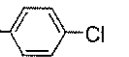
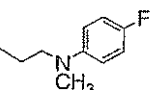
10

20

30

40

【表 100】

C784			
C785			
C786			
C787			
C788			
C789			
C790			
C791			
C792			
C793			
C794			
C795			
C796			
C797			
C798			
C799			

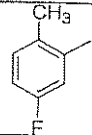
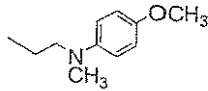
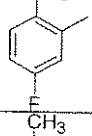
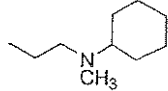
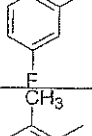
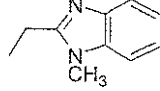
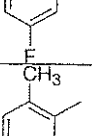
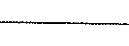
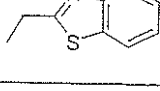
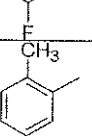
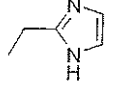
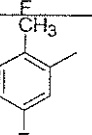
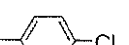
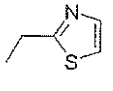
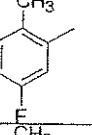
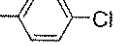
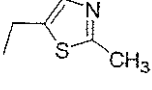
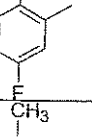
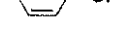
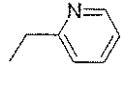
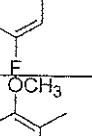
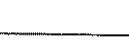
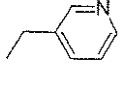
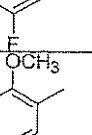
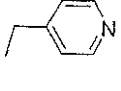
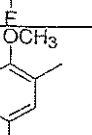
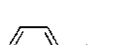
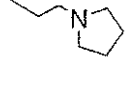
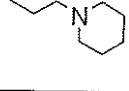
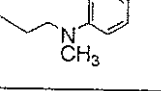
10

20

30

40

【表 101】

C800			
C801			
C802			
C803			
C804			
C805			
C806			
C807			
C808			
C809			
C810			
C811			
C812			

10

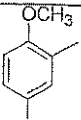
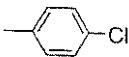
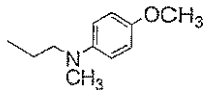
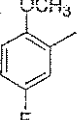
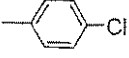
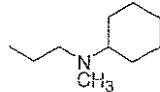
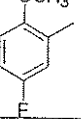
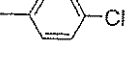
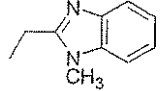
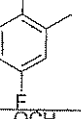
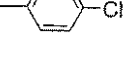
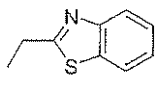
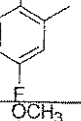
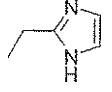
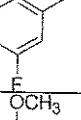
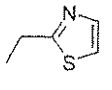
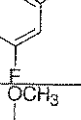
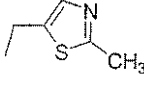
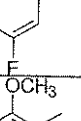
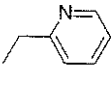
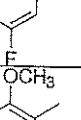
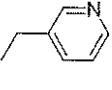
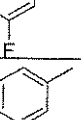
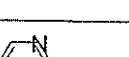
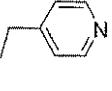
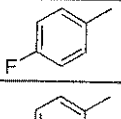
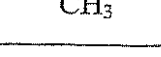
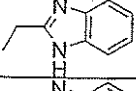
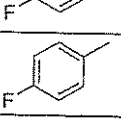
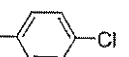
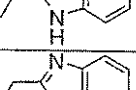
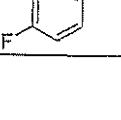
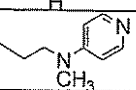
20

30

40

【0152】

【表 1 0 2】

C813			
C814			
C815			
C816			
C817			
C818			
C819			
C820			
C821			
C822			
C823			
C824			
C825			
C826			
C827			

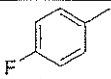
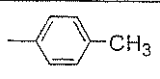
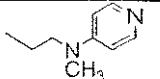
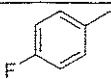
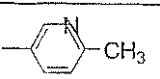
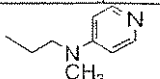
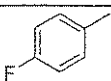
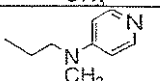
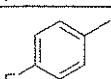
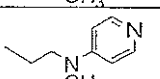
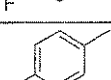
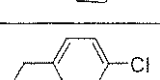
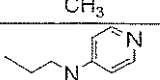
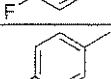
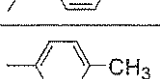
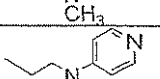
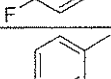
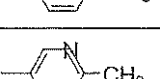
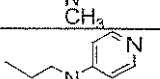
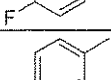
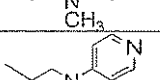
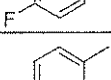
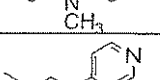
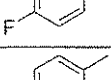
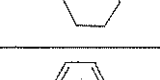
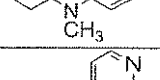
10

20

30

40

【表 103】

C828			
C829			
C830		CH ₃	
C831			
C832			
C833			
C834			
C835		CH ₃	
C836			
C837			

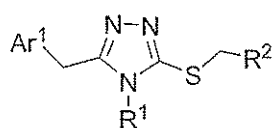
10

20

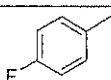
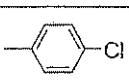
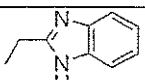
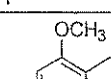
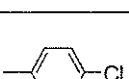
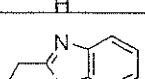
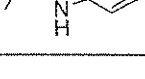
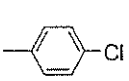
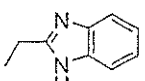
【0154】

【表 104】

表 C1G



30

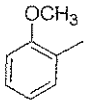
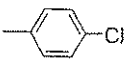
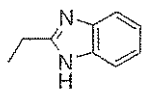
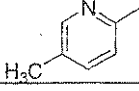
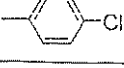
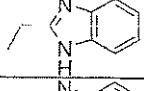
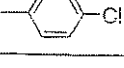
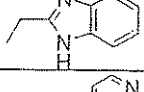
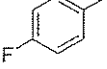
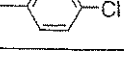
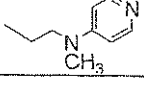
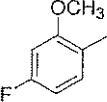
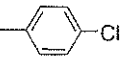
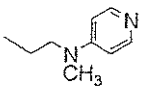
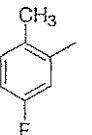
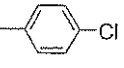
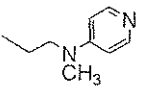
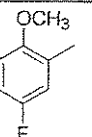
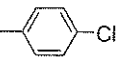
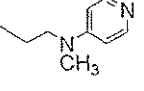
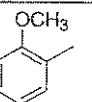
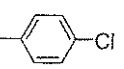
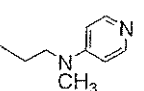
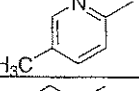
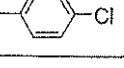
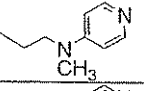
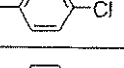
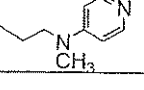
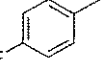
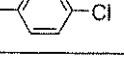
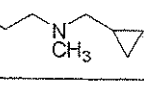
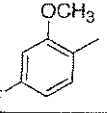
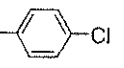
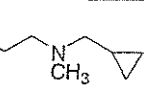
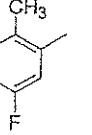
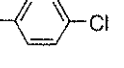
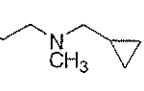
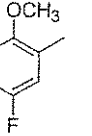
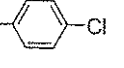
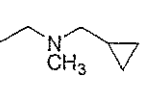
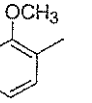
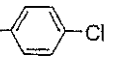
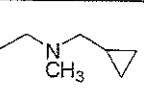
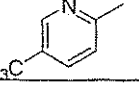
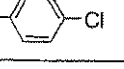
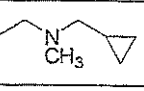
Cpd. No.	Ar ¹	R ¹	R ²
C838			
C839			
C840			
C841			

40

【0155】

50

【表 105】

C842			
C843			
C844			
C845			
C846			
C847			
C848			
C849			
C850			
C851			
C852			
C853			
C854			
C855			
C856			
C857			

10

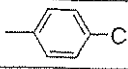
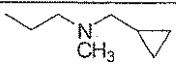
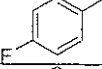
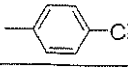
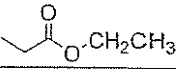
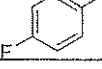
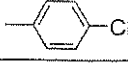
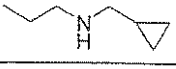
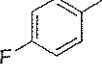
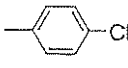
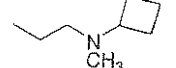
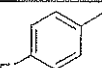
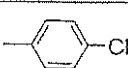
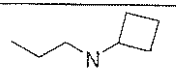
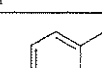
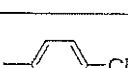
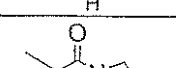
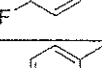
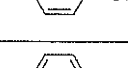
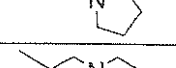
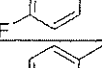
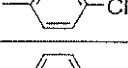
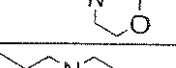
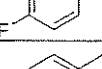
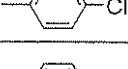
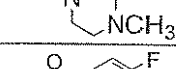
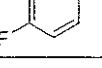
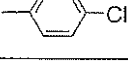
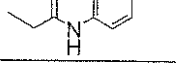
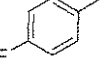
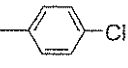
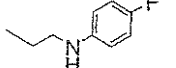
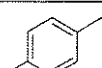
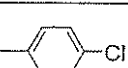
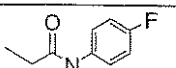
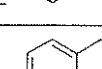
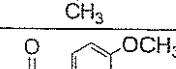
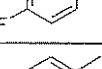
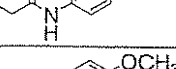
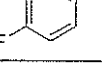
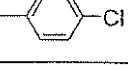
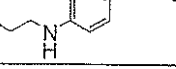
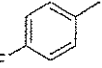
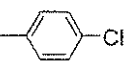
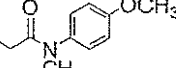
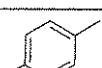
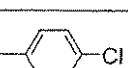
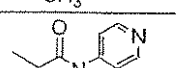
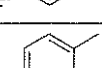
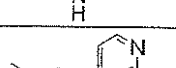
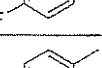
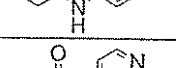
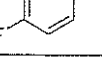
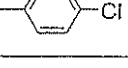
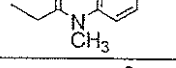
20

30

40

【0156】

【表 106】

C858			
C859			
C860			
C861			
C862			
C863			
C864			
C865			
C866			
C867			
C868			
C869			
C870			
C871			
C872			
C873			
C874			
C875			
C876			
C877			

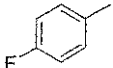
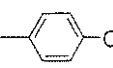
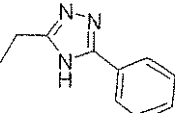
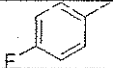
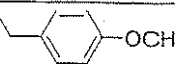
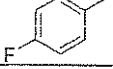
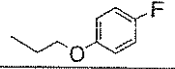
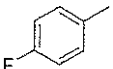
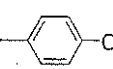
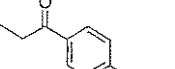
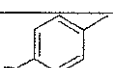
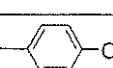
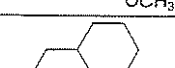
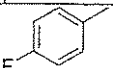
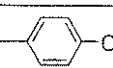
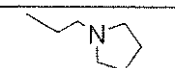
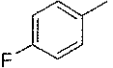
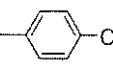
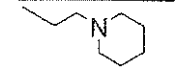
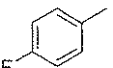
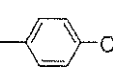
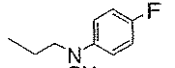
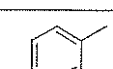
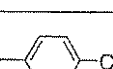
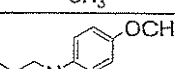
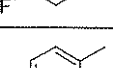
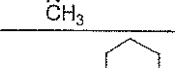
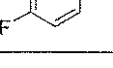
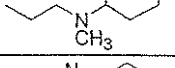
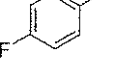
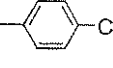
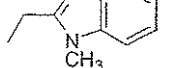
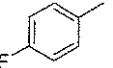
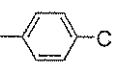
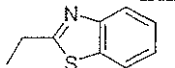
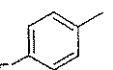
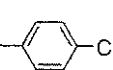
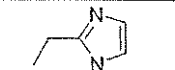
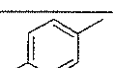
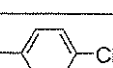
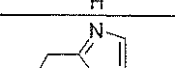
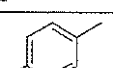
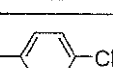
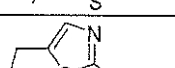
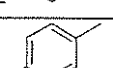
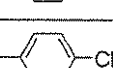
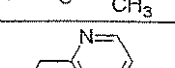
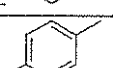
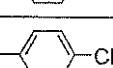
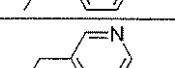
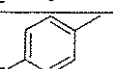
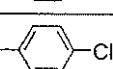
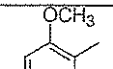
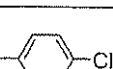
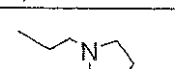
10

20

30

40

【表 107】

C878			
C879			
C880			
C881			
C882			
C883			
C884			
C885			
C886			
C887			
C888			
C889			
C890			
C891			
C892			
C893			
C894			
C895			
C896			
C897			

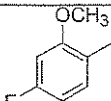
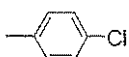
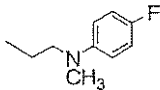
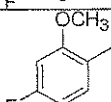
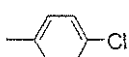
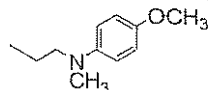
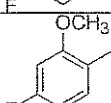
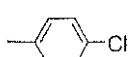
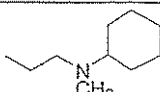
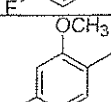
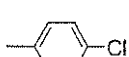
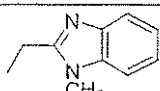
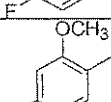
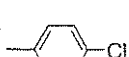
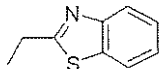
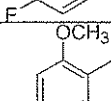
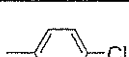
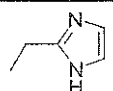
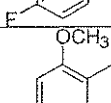
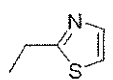
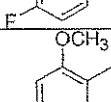
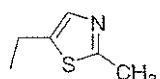
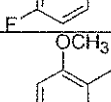
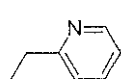
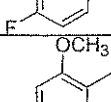
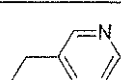
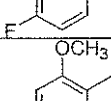
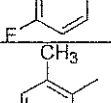
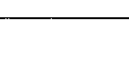
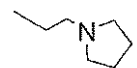
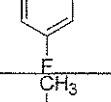
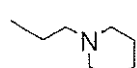
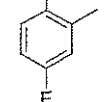
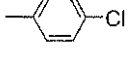
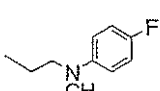
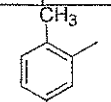
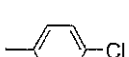
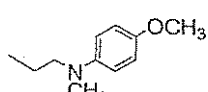
10

20

30

40

【表 108】

C898			
C899			
C900			
C901			
C902			
C903			
C904			
C905			
C906			
C907			
C908			
C909			
C910			
C911			
C912			

10

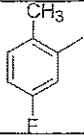
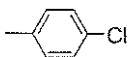
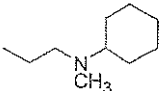
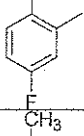
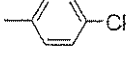
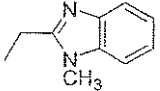
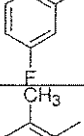
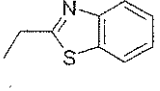
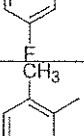
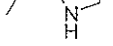
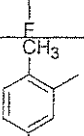
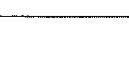
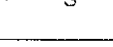
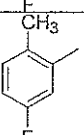
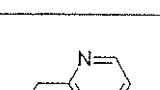
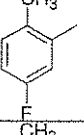
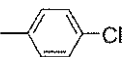
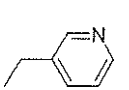
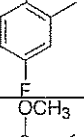
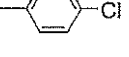
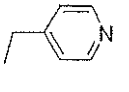
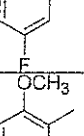
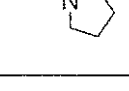
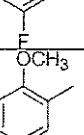
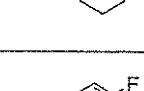
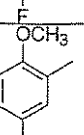
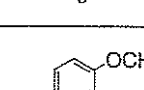
20

30

40

【0159】

【表 109】

C913			
C914			
C915			
C916			
C917			
C918			
C919			
C920			
C921			
C922			
C923			
C924			
C925			

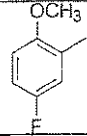
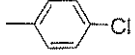
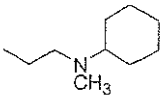
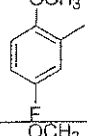
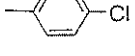
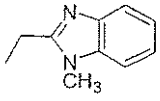
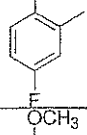
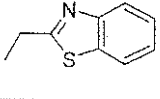
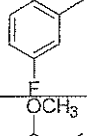
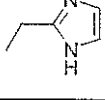
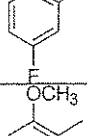
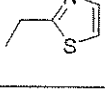
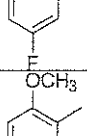
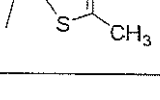
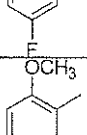
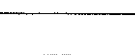
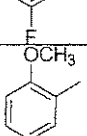
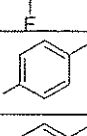
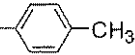
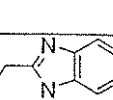
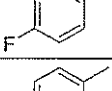
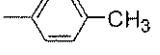
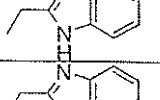
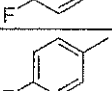
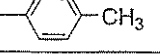
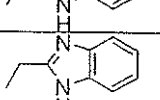
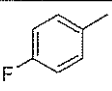
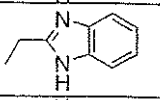
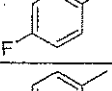
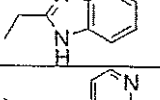
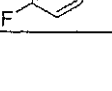
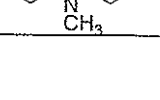
10

20

30

40

【表 1 1 0】

C926			
C927			
C928			
C929			
C930			
C931			
C932			
C933			
C934			
C935			
C936			
C937			
C938			
C939			
C940			

10

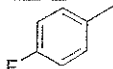
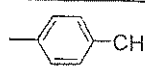
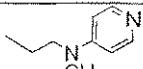
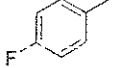
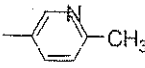
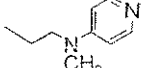
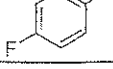
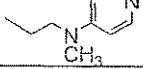
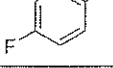
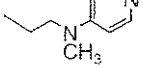
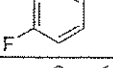
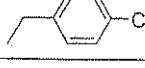
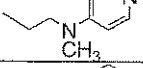
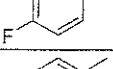
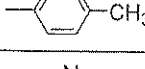
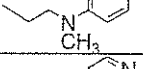
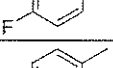
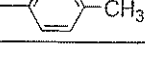
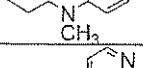
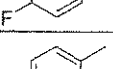
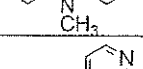
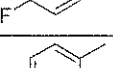
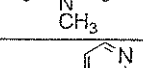
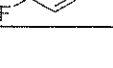
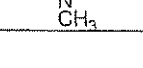
20

30

40

【0 1 6 1】

【表 1 1 1】

C941			
C942			
C943		CH ₃	
C944			
C945			
C946			
C947			
C948		CH ₃	
C949			
C950			

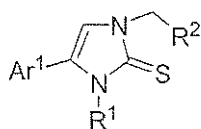
10

20

【0 1 6 2】

【表 1 1 2】

表 D-1



Cpd no.	Ar ¹	R ¹	R ²
D1			
D2			
D3			
D4			
D5			
D6			
D7			
D8			
D9			
D10			

10

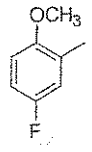
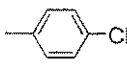
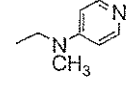
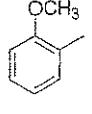
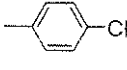
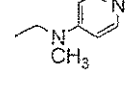
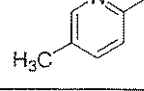
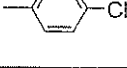
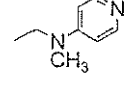
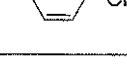
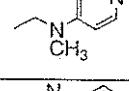
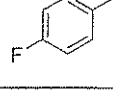
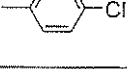
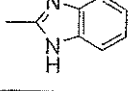
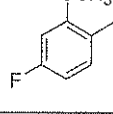
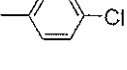
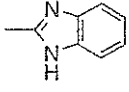
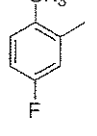
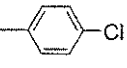
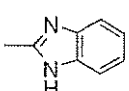
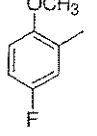
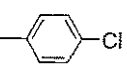
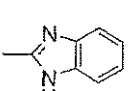
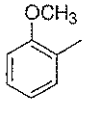
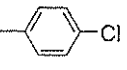
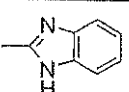
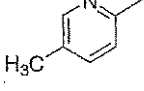
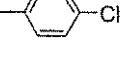
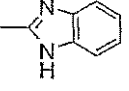
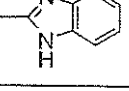
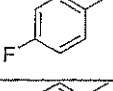
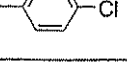
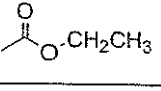
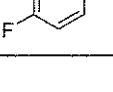
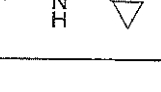
20

30

40

【0 1 6 3】

【表 1 1 3】

D11			
D12			
D13			
D14			
D15			
D16			
D17			
D18			
D19			
D20			
D21			
D22			
D23			

10

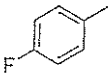
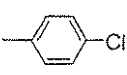
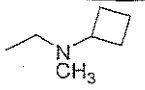
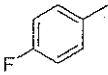
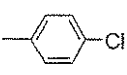
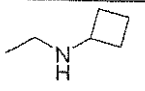
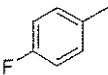
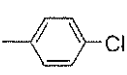
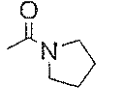
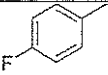
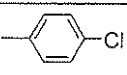
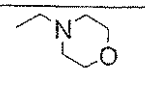
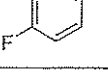
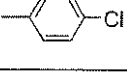
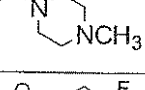
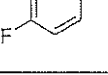
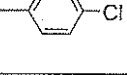
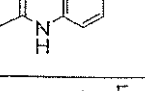
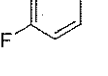
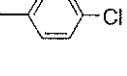
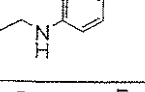
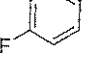
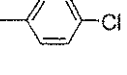
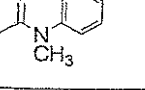
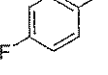
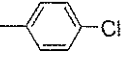
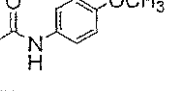
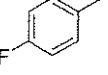
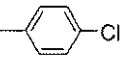
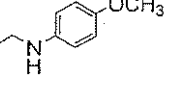
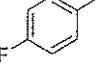
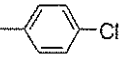
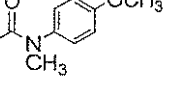
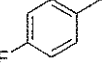
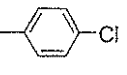
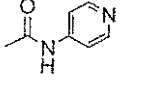
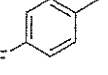
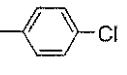
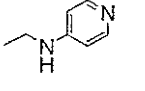
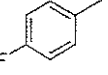
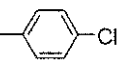
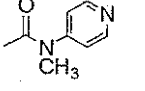
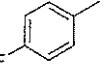
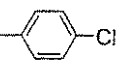
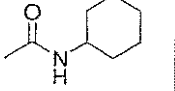
20

30

40

【0 1 6 4】

【表 1 1 4】

D24			
D25			
D26			
D27			
D28			
D29			
D30			
D31			
D32			
D33			
D34			
D35			
D36			
D37			
D38			

10

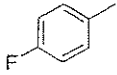
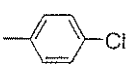
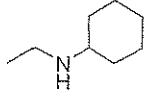
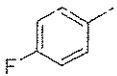
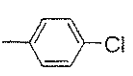
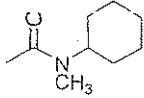
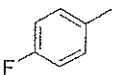
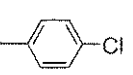
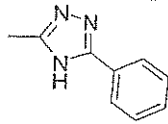
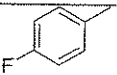
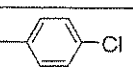
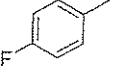
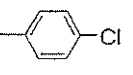
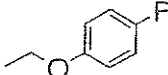
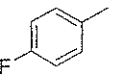
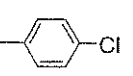
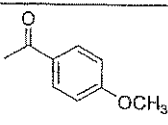
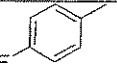
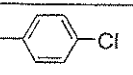
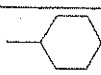
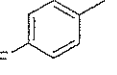
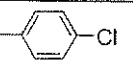
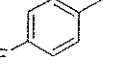
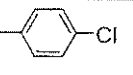
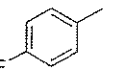
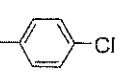
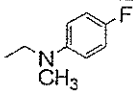
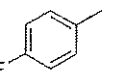
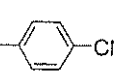
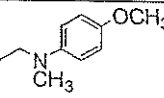
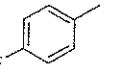
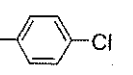
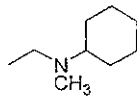
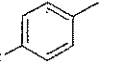
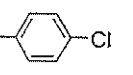
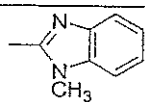
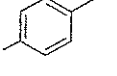
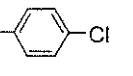
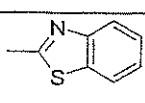
20

30

40

【0 1 6 5】

【表 1 1 5】

D39			
D40			
D41			
D42			
D43			
D44			
D45			
D46			
D47			
D48			
D49			
D50			
D51			
D52			

10

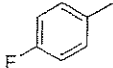
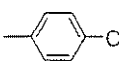
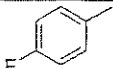
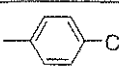
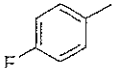
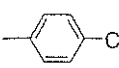
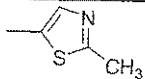
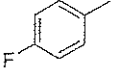
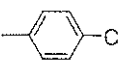
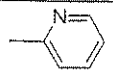
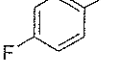
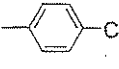
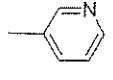
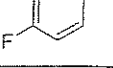
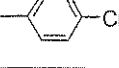
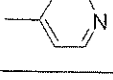
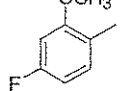
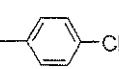
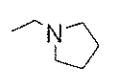
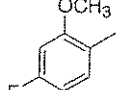
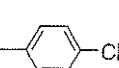
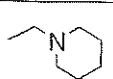
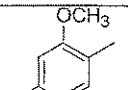
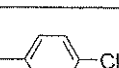
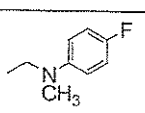
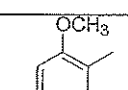
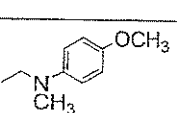
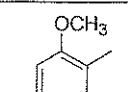
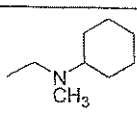
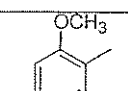
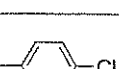
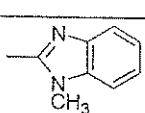
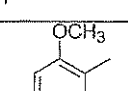
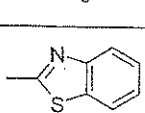
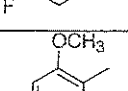
20

30

40

【0 1 6 6】

【表 1 1 6】

D53			
D54			
D55			
D56			
D57			
D58			
D59			
D60			
D61			
D62			
D63			
D64			
D65			
D66			

10

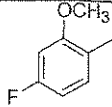
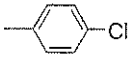
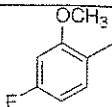
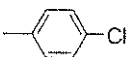
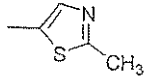
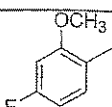
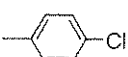
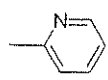
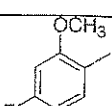
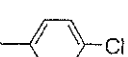
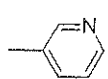
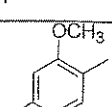
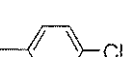
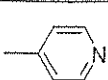
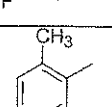
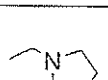
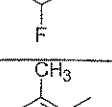
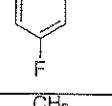
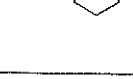
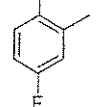
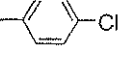
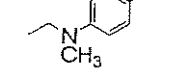
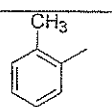
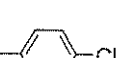
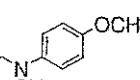
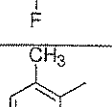
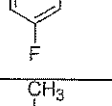
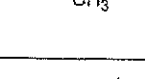
20

30

40

【0 1 6 7】

【表 1 1 7】

D67			
D68			
D69			
D70			
D71			
D72			
D73			
D74			
D75			
D76			
D77			
D78			

10

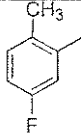
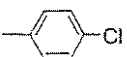
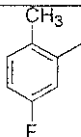
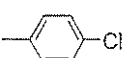
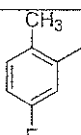
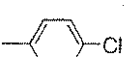
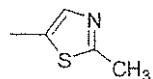
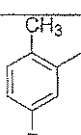
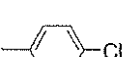
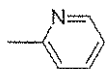
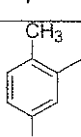
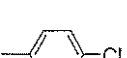
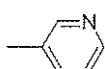
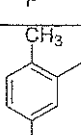
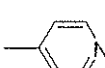
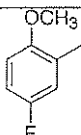
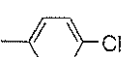
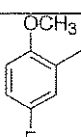
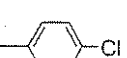
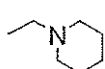
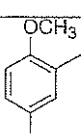
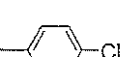
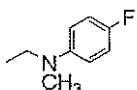
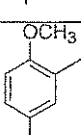
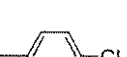
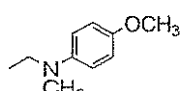
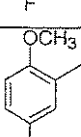
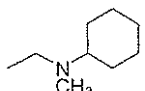
20

30

40

【0 1 6 8】

【表 1 1 8】

D79			
D80			
D81			
D82			
D83			
D84			
D85			
D86			
D87			
D88			
D89			

10

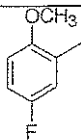
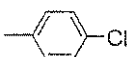
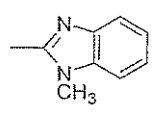
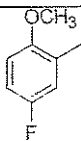
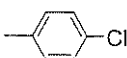
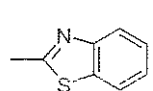
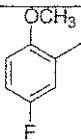
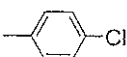
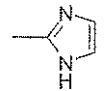
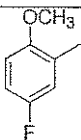
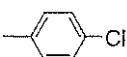
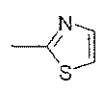
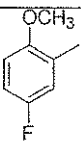
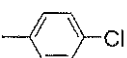
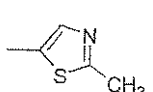
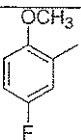
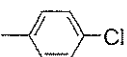
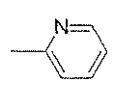
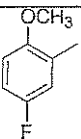
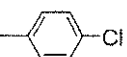
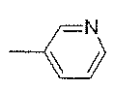
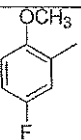
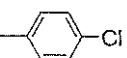
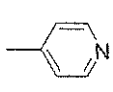
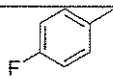
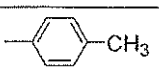
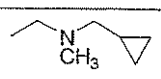
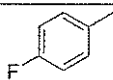
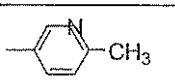
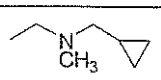
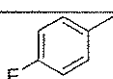
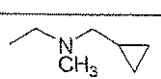
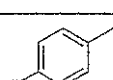
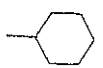
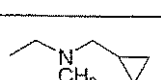
20

30

40

【0 1 6 9】

【表 1 1 9】

D90			
D91			
D92			
D93			
D94			
D95			
D96			
D97			
D98			
D99			
D100			
D101			

10

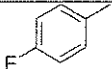
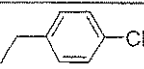
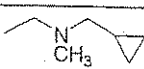
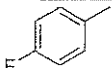
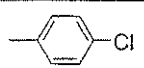
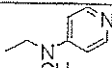
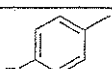
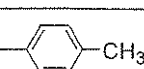
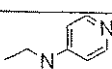
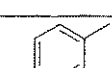
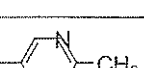
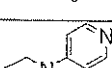
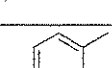
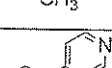
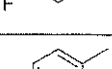
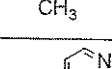
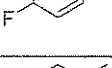
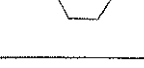
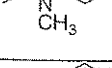
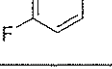
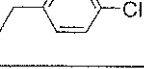
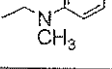
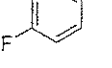
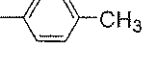
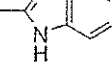
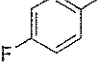
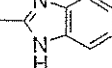
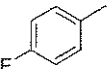
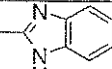
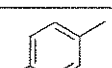
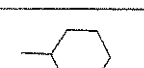
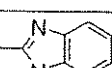
20

30

40

【0 1 7 0】

【表 1 2 0】

D102			
D103			
D104			
D105			
D106		CH_3	
D107			
D108			
D109			
D110			
D111		CH_3	
D112			
D113			

10

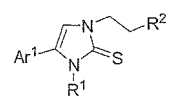
20

30

【0 1 7 1】

【表 1 2 1】

表 D-2



Cpd no.	Ar ¹	R ¹	R ²
D114			
D115			
D116			
D117			
D118			
D119			
D120			
D121			
D122			
D123			
D124			
D125			

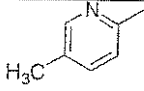
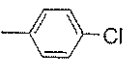
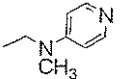
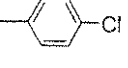
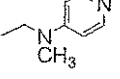
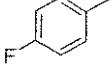
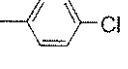
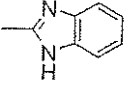
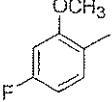
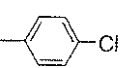
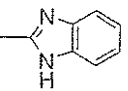
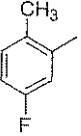
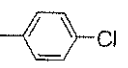
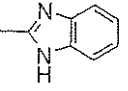
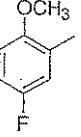
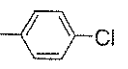
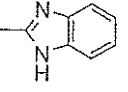
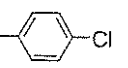
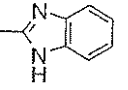
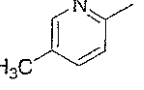
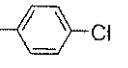
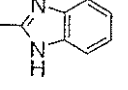
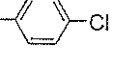
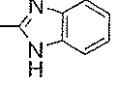
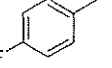
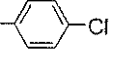
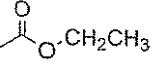
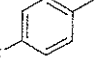
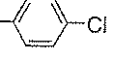
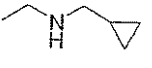
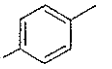
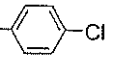
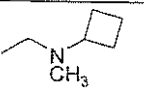
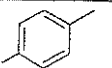
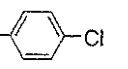
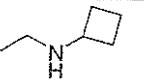
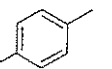
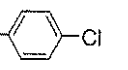
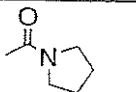
10

20

30

【 0 1 7 2 】

【表 1 2 2】

D126			
D127			
D128			
D129			
D130			
D131			
D132			
D133			
D134			
D135			
D136			
D137			
D138			
D139			

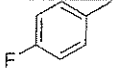
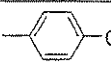
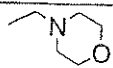
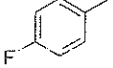
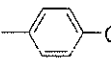
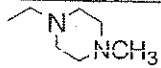
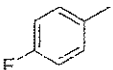
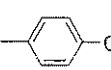
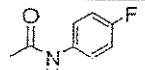
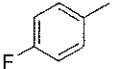
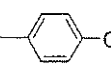
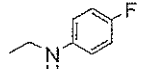
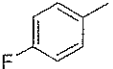
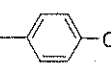
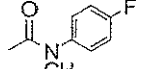
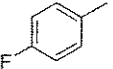
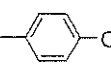
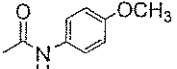
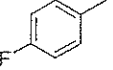
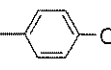
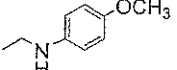
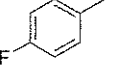
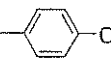
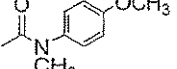
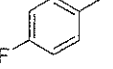
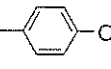
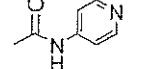
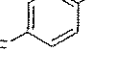
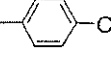
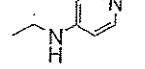
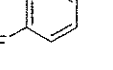
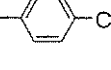
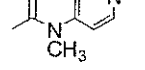
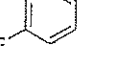
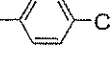
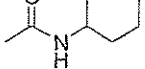
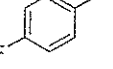
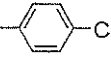
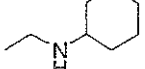
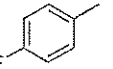
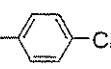
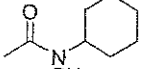
10

20

30

40

【表 1 2 3】

D140			
D141			
D142			
D143			
D144			
D145			
D146			
D147			
D148			
D149			
D150			
D151			
D152			
D153			

10

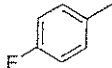
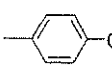
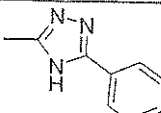
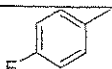
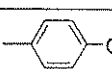
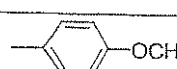
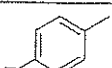
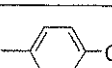
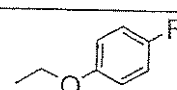
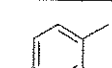
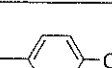
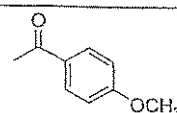
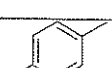
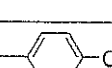
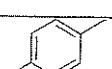
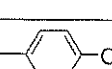
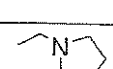
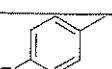
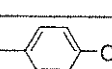
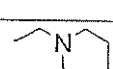
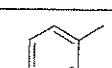
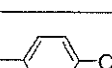
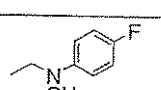
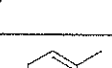
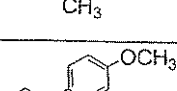
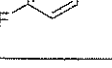
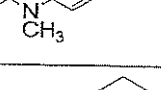
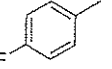
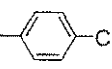
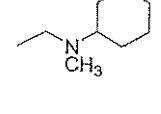
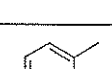
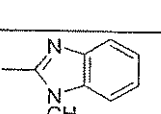
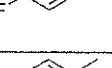
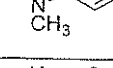
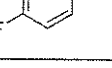
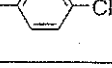
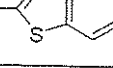
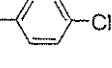
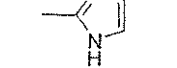
20

30

40

【0 1 7 4】

【表 1 2 4】

D154			
D155			
D156			
D157			
D158			
D159			
D160			
D161			
D162			
D163			
D164			
D165			
D166			
D167			
D168			

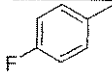
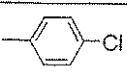
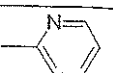
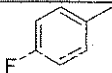
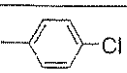
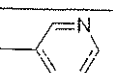
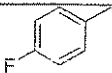
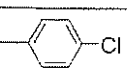
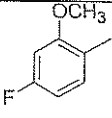
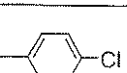
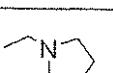
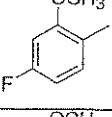
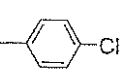
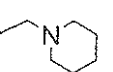
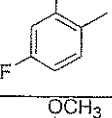
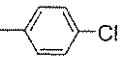
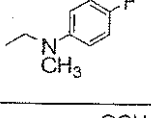
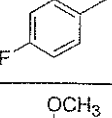
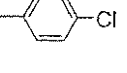
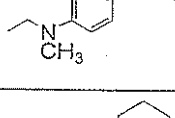
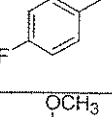
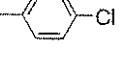
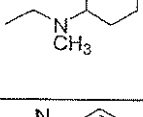
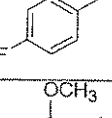
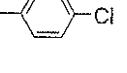
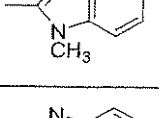
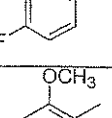
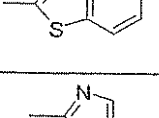
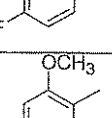
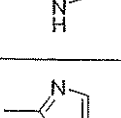
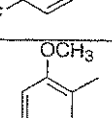
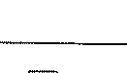
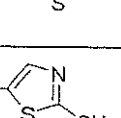
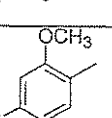
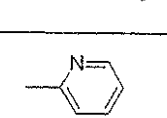
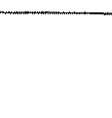
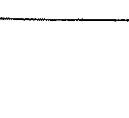
10

20

30

40

【表 1 2 5】

D169			
D170			
D171			
D172			
D173			
D174			
D175			
D176			
D177			
D178			
D179			
D180			
D181			
D182			

10

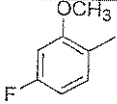
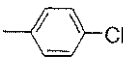
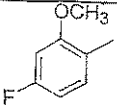
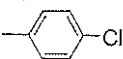
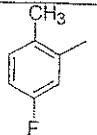
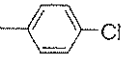
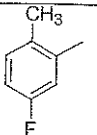
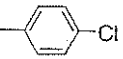
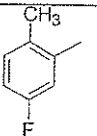
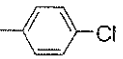
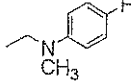
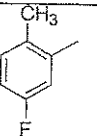
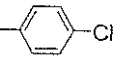
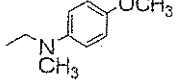
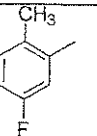
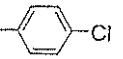
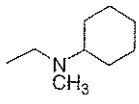
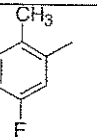
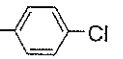
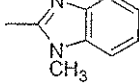
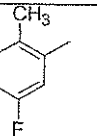
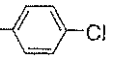
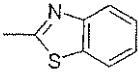
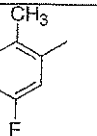
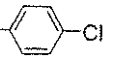
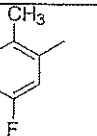
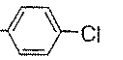
20

30

40

【0 1 7 6】

【表 1 2 6】

D183			
D184			
D185			
D186			
D187			
D188			
D189			
D190			
D191			
D192			
D193			

10

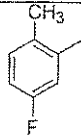
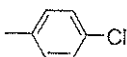
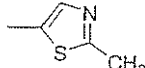
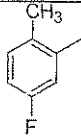
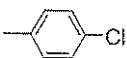
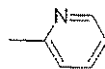
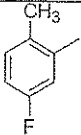
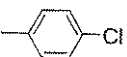
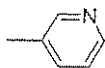
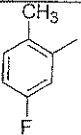
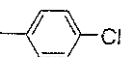
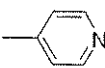
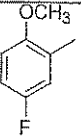
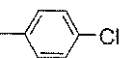
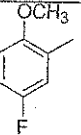
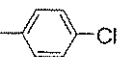
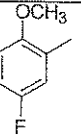
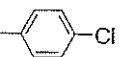
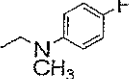
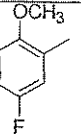
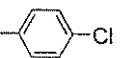
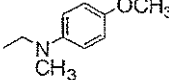
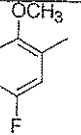
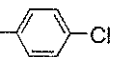
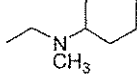
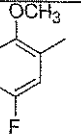
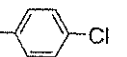
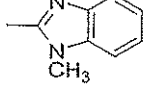
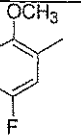
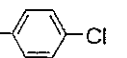
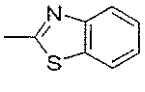
20

30

40

【0 1 7 7】

【表 1 2 7】

D194			
D195			
D196			
D197			
D198			
D199			
D200			
D201			
D202			
D203			
D204			

10

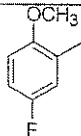
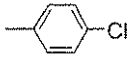
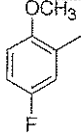
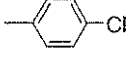
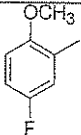
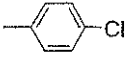
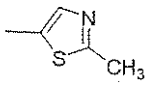
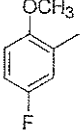
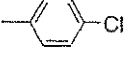
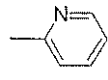
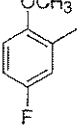
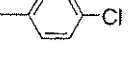
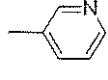
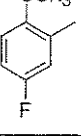
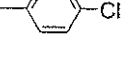
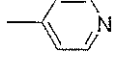
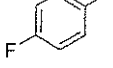
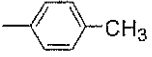
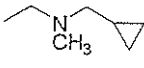
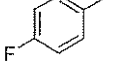
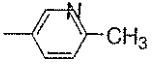
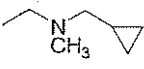
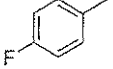
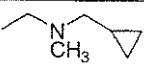
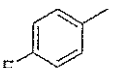
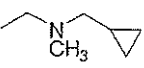
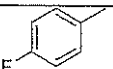
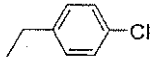
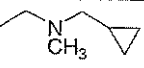
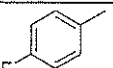
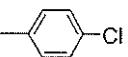
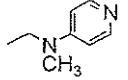
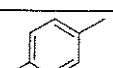
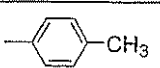
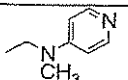
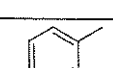
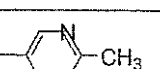
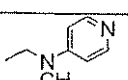
20

30

40

【0 1 7 8】

【表 1 2 8】

D205			
D206			
D207			
D208			
D209			
D210			
D211			
D212			
D213		CH_3	
D214			
D215			
D216			
D217			
D218			

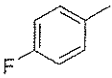
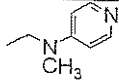
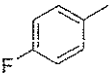
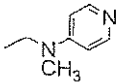
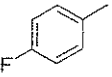
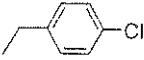
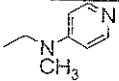
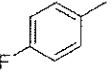
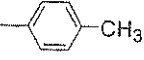
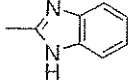
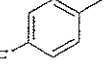
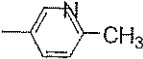
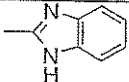
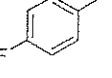
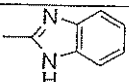
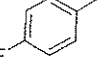
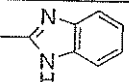
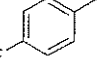
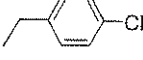
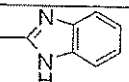
10

20

30

40

【表 1 2 9】

D219		CH ₃	
D220			
D221			
D222			
D223			
D224		CH ₃	
D225			
D226			

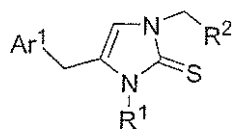
10

20

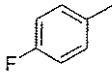
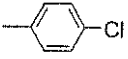
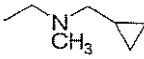
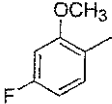
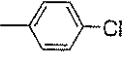
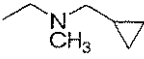
【0 1 8 0】

【表 1 3 0】

表 D-3



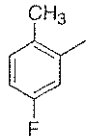
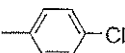
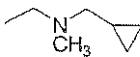
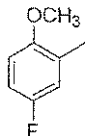
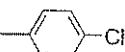
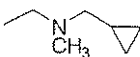
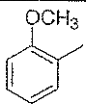
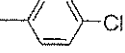
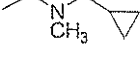
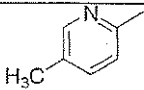
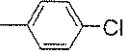
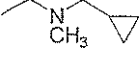
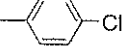
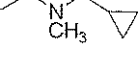
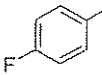
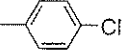
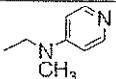
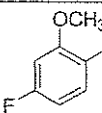
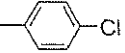
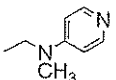
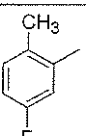
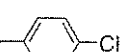
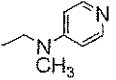
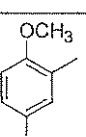
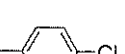
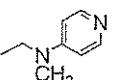
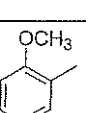
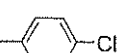
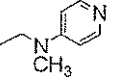
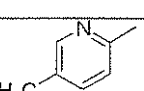
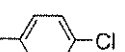
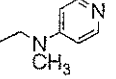
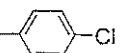
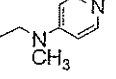
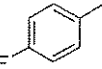
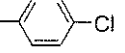
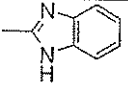
30

Cpd no.	Ar ¹	R ¹	R ²
D227			
D228			

40

【0 1 8 1】

【表 1 3 1】

D229			
D230			
D231			
D232			
D233			
D234			
D235			
D236			
D237			
D238			
D239			
D240			
D241			

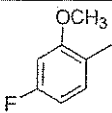
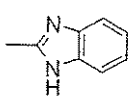
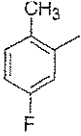
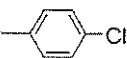
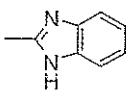
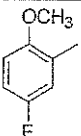
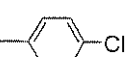
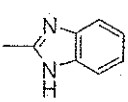
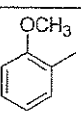
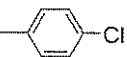
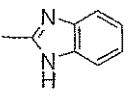
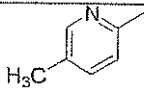
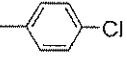
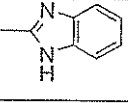
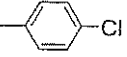
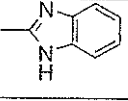
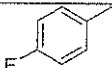
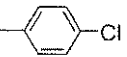
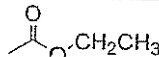
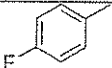
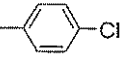
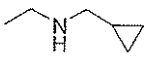
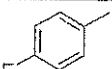
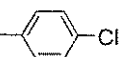
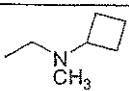
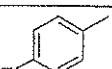
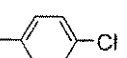
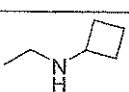
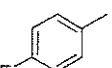
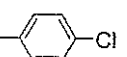
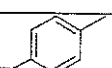
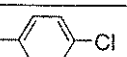
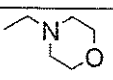
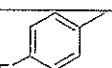
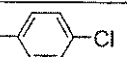
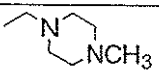
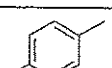
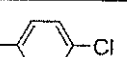
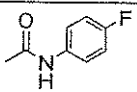
10

20

30

40

【表 1 3 2】

D242			
D243			
D244			
D245			
D246			
D247			
D248			
D249			
D250			
D251			
D252			
D253			
D254			
D255			

10

20

30

40

【0 1 8 3】

【表 1 3 3】

D256			
D257			
D258			
D259			
D260			
D261			
D262			
D263			
D264			
D265			
D266			
D267			
D268			
D269			

10

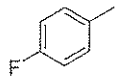
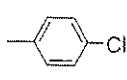
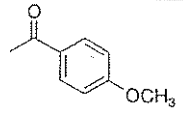
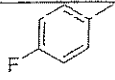
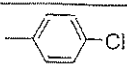
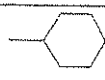
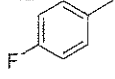
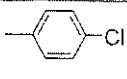
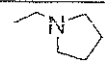
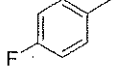
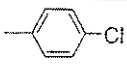
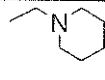
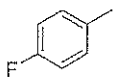
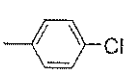
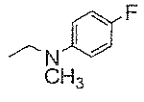
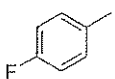
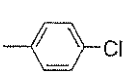
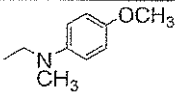
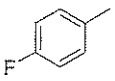
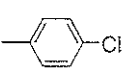
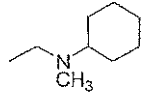
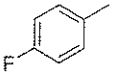
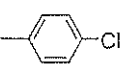
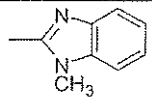
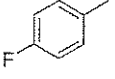
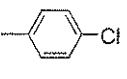
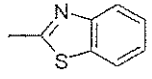
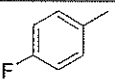
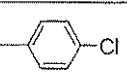
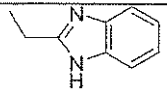
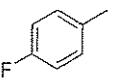
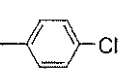
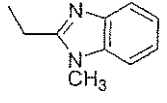
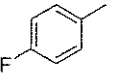
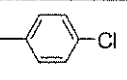
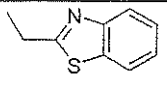
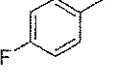
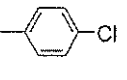
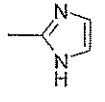
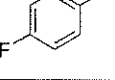
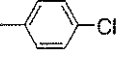
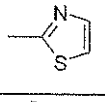
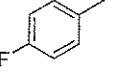
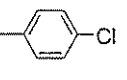
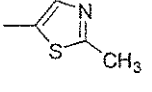
20

30

40

【0 1 8 4】

【表 1 3 4】

D270			
D271			
D272			
D273			
D274			
D275			
D276			
D277			
D278			
D279			
D280			
D281			
D282			
D283			
D284			

10

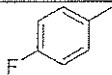
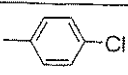
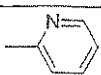
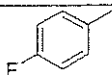
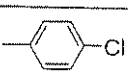
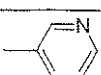
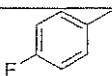
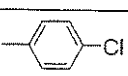
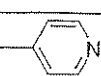
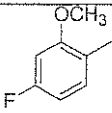
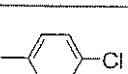
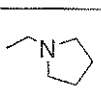
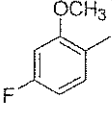
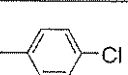
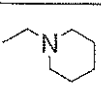
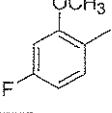
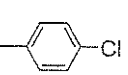
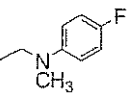
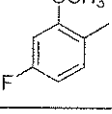
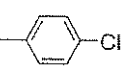
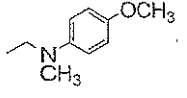
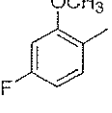
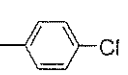
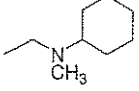
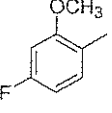
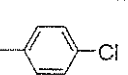
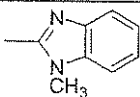
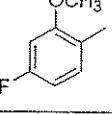
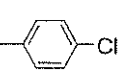
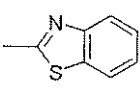
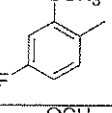
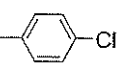
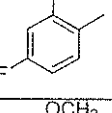
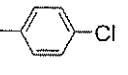
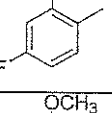
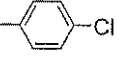
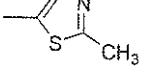
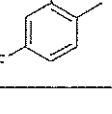
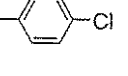
20

30

40

【0 1 8 5】

【表 1 3 5】

D285			
D286			
D287			
D288			
D289			
D290			
D291			
D292			
D293			
D294			
D295			
D296			
D297			
D298			

10

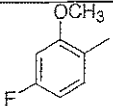
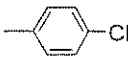
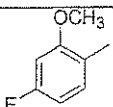
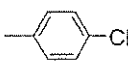
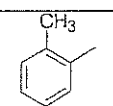
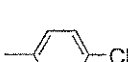
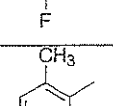
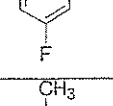
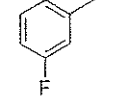
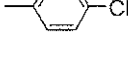
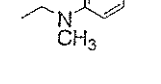
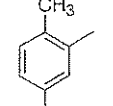
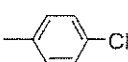
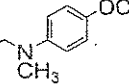
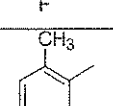
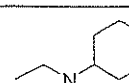
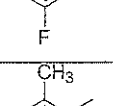
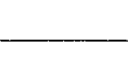
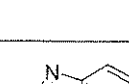
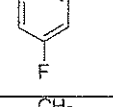
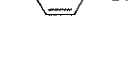
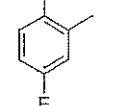
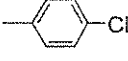
20

30

40

【0 1 8 6】

【表 1 3 6】

D299			
D300			
D301			
D302			
D303			
D304			
D305			
D306			
D307			
D308			
D309			

10

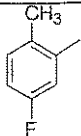
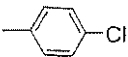
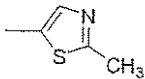
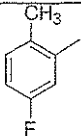
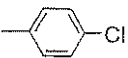
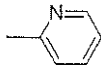
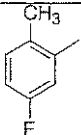
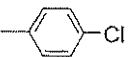
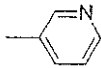
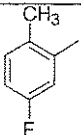
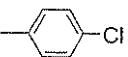
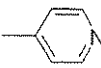
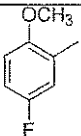
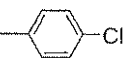
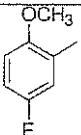
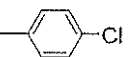
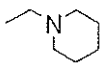
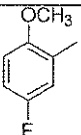
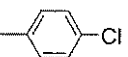
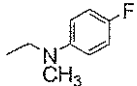
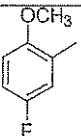
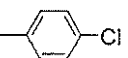
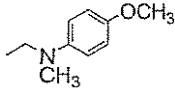
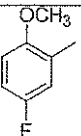
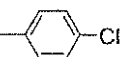
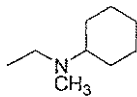
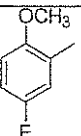
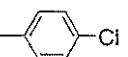
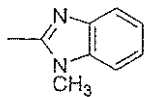
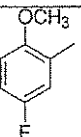
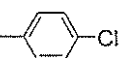
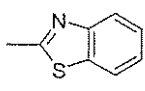
20

30

40

【0 1 8 7】

【表 1 3 7】

D310			
D311			
D312			
D313			
D314			
D315			
D316			
D317			
D318			
D319			
D320			

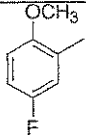
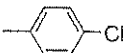
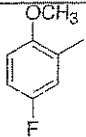
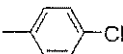
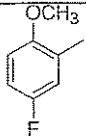
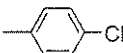
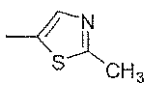
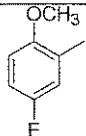
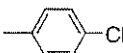
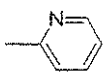
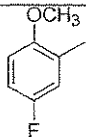
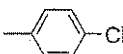
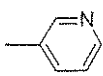
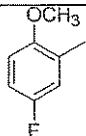
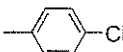
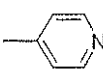
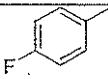
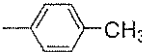
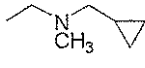
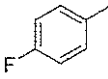
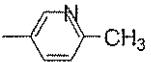
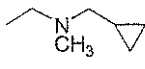
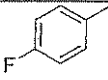
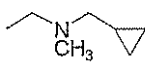
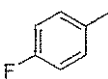
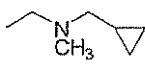
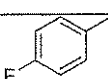
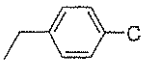
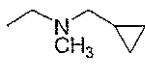
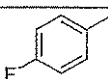
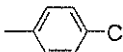
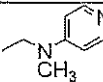
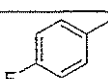
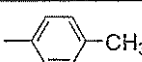
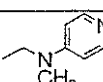
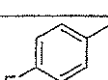
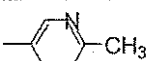
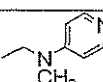
10

20

30

40

【表 1 3 8】

D321			
D322			
D323			
D324			
D325			
D326			
D327			
D328			
D329		CH_3	
D330			
D331			
D332			
D333			
D334			

10

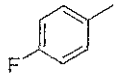
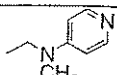
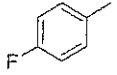
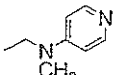
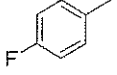
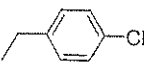
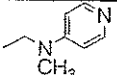
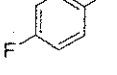
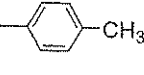
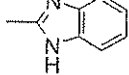
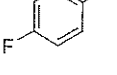
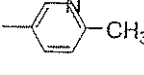
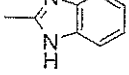
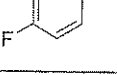
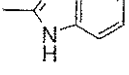
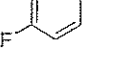
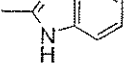
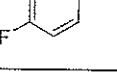
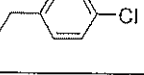
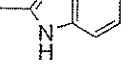
20

30

40

【0 1 8 9】

【表 1 3 9】

D335		CH ₃	
D336			
D337			
D338			
D339			
D340		CH ₃	
D341			
D342			

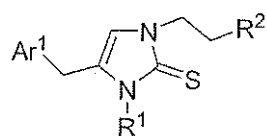
10

20

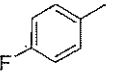
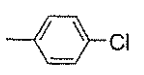
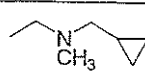
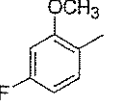
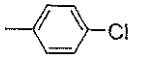
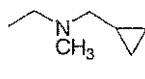
【0 1 9 0】

【表 1 4 0】

表 D-4



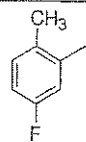
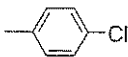
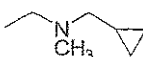
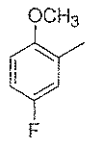
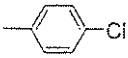
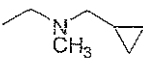
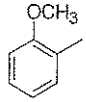
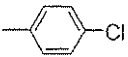
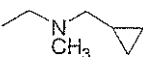
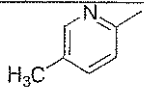
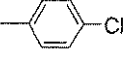
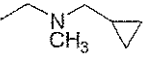
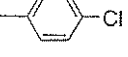
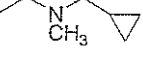
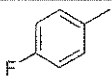
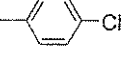
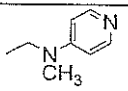
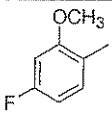
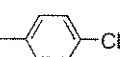
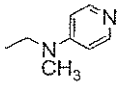
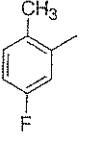
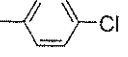
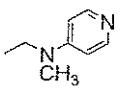
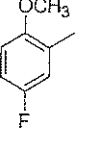
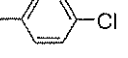
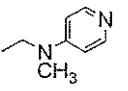
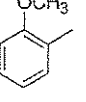
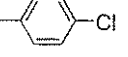
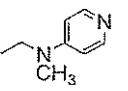
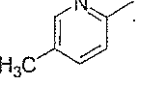
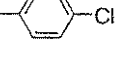
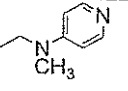
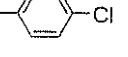
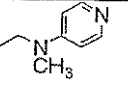
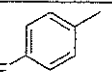
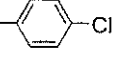
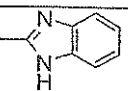
30

Cpd no.	Ar ¹	R ¹	R ²
D343			
D344			

40

【0 1 9 1】

【表 1 4 1】

D345			
D346			
D347			
D348			
D349			
D350			
D351			
D352			
D353			
D354			
D355			
D356			
D357			

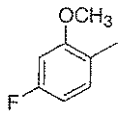
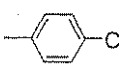
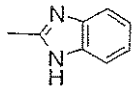
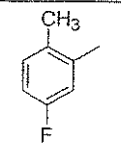
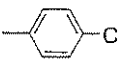
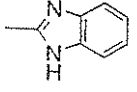
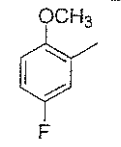
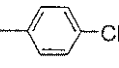
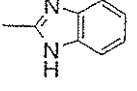
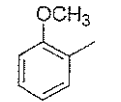
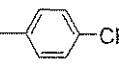
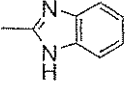
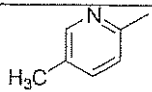
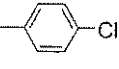
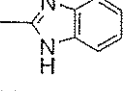
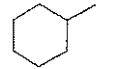
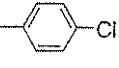
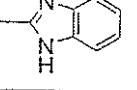
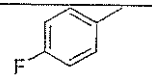
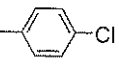
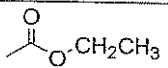
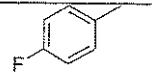
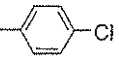
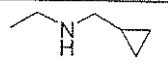
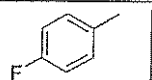
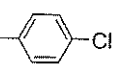
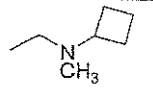
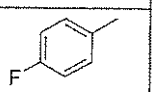
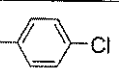
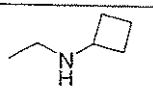
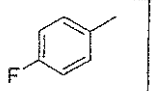
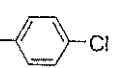
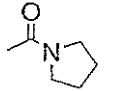
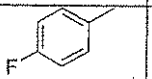
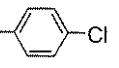
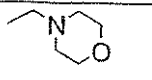
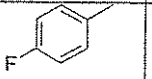
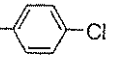
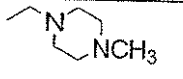
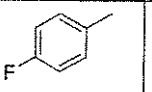
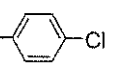
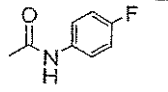
10

20

30

40

【表 1 4 2】

D358			
D359			
D360			
D361			
D362			
D363			
D364			
D365			
D366			
D367			
D368			
D369			
D370			
D371			

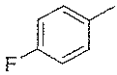
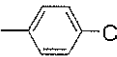
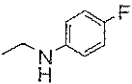
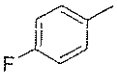
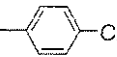
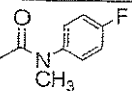
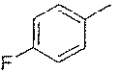
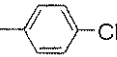
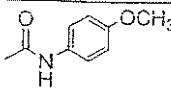
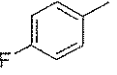
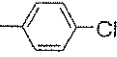
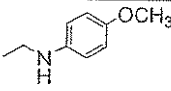
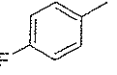
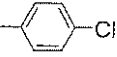
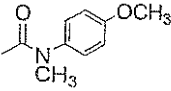
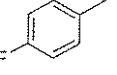
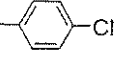
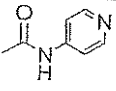
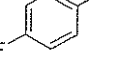
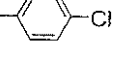
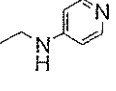
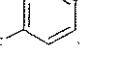
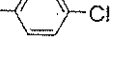
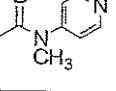
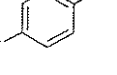
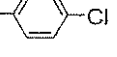
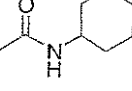
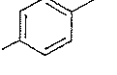
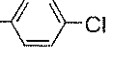
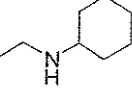
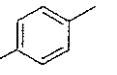
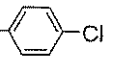
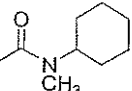
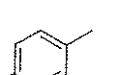
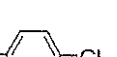
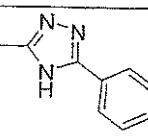
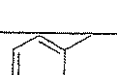
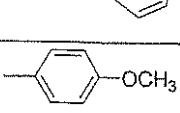
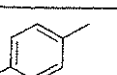
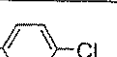
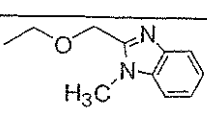
10

20

30

40

【表 1 4 3】

D372			
D373			
D374			
D375			
D376			
D377			
D378			
D379			
D380			
D381			
D382			
D383			
D384			
D385			

10

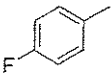
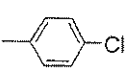
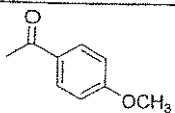
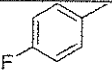
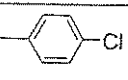
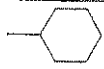
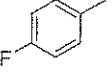
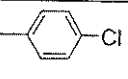
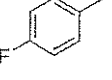
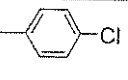
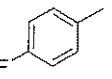
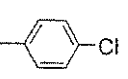
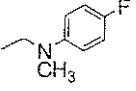
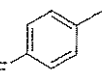
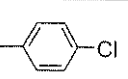
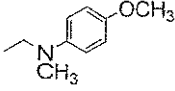
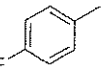
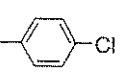
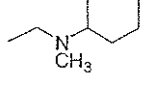
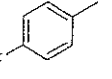
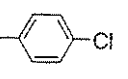
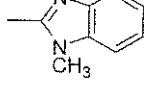
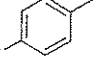
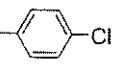
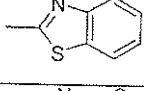
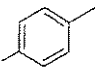
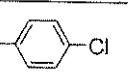
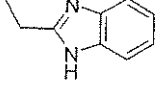
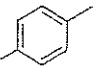
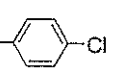
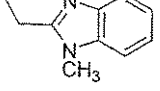
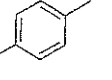
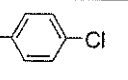
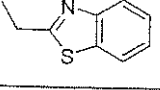
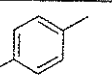
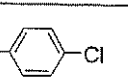
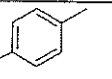
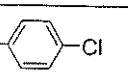
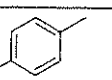
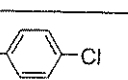
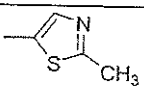
20

30

40

【0 1 9 4】

【表 1 4 4】

D386			
D387			
D388			
D389			
D390			
D391			
D392			
D393			
D394			
D395			
D396			
D397			
D398			
D399			
D400			

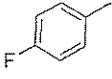
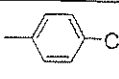
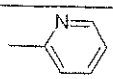
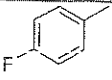
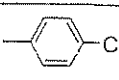
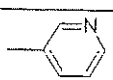
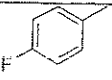
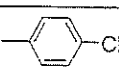
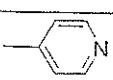
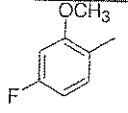
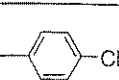
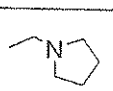
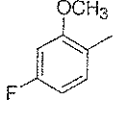
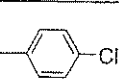
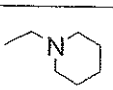
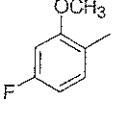
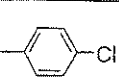
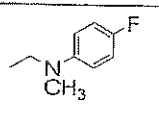
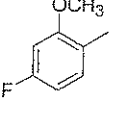
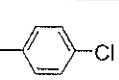
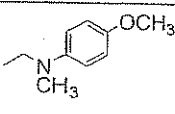
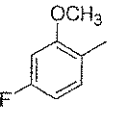
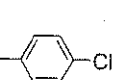
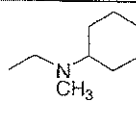
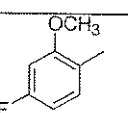
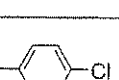
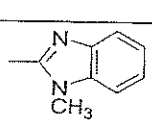
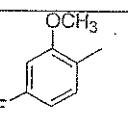
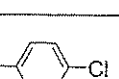
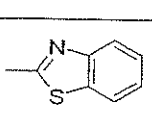
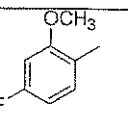
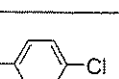
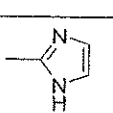
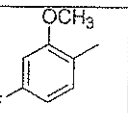
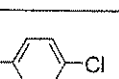
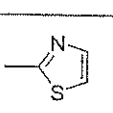
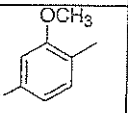
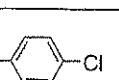
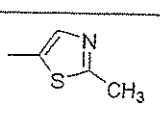
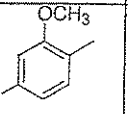
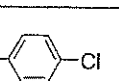
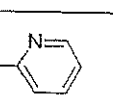
10

20

30

40

【表 1 4 5】

D401			
D402			
D403			
D404			
D405			
D406			
D407			
D408			
D409			
D410			
D411			
D412			
D413			
D414			

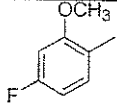
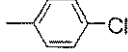
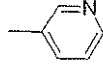
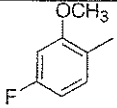
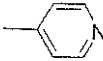
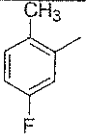
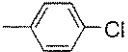
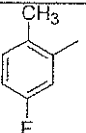
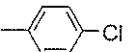
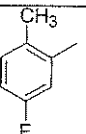
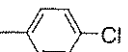
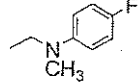
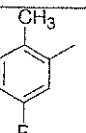
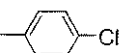
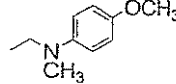
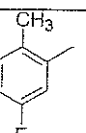
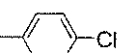
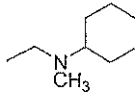
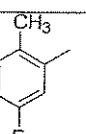
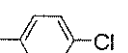
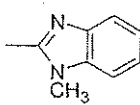
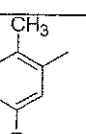
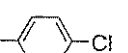
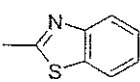
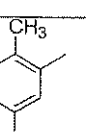
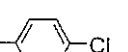
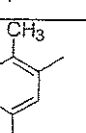
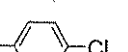
10

20

30

40

【表 1 4 6】

D415			
D416			
D417			
D418			
D419			
D420			
D421			
D422			
D423			
D424			
D425			

10

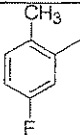
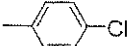
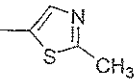
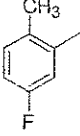
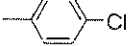
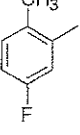
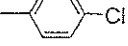
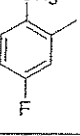
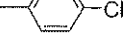
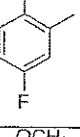
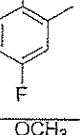
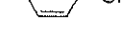
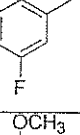
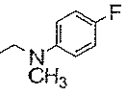
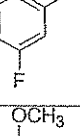
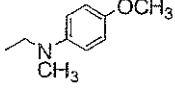
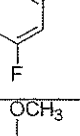
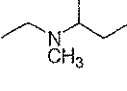
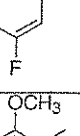
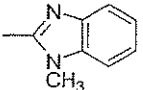
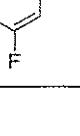
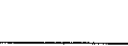
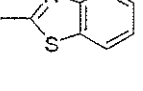
20

30

40

【0 1 9 7】

【表 1 4 7】

D426			
D427			
D428			
D429			
D430			
D431			
D432			
D433			
D434			
D435			
D436			

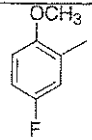
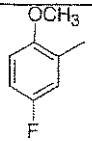
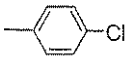
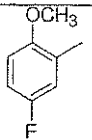
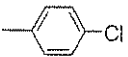
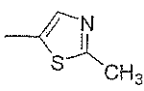
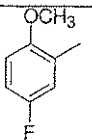
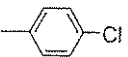
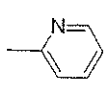
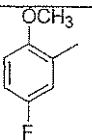
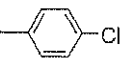
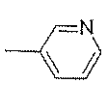
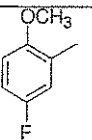
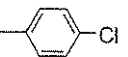
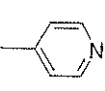
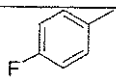
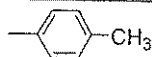
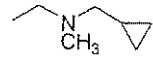
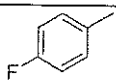
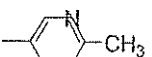
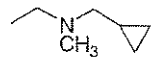
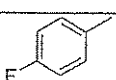
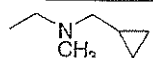
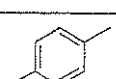
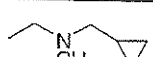
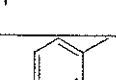
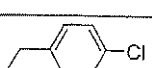
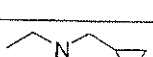
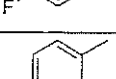
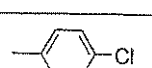
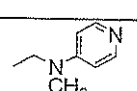
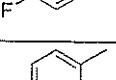
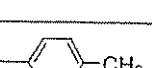
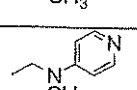
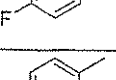
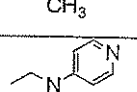
10

20

30

40

【表 1 4 8】

D437			
D438			
D439			
D440			
D441			
D442			
D443			
D444			
D445			
D446			
D447			
D448			
D449			
D450			

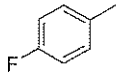
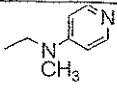
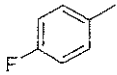
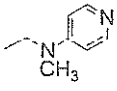
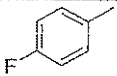
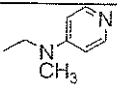
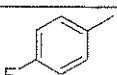
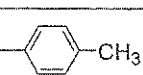
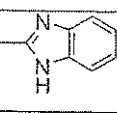
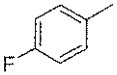
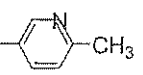
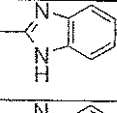
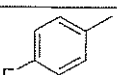
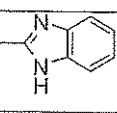
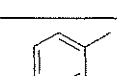
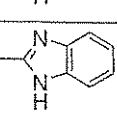
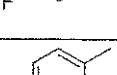
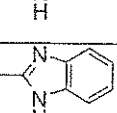
10

20

30

40

【表 1 4 9】

D451		CH ₃	
D452			
D453			
D454			
D455			
D456		CH ₃	
D457			
D458			

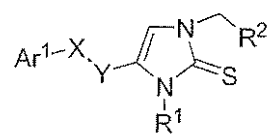
10

20

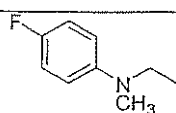
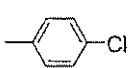
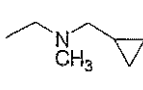
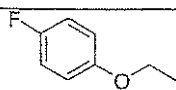
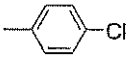
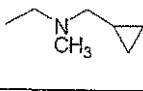
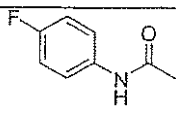
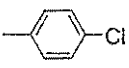
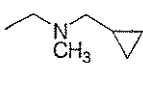
【0 2 0 0】

【表 1 5 0】

表 D-5



30

Cpd. No.	Ar ¹ -X-Y	R ¹	R ²
D459			
D460			
D461			

40

【0 2 0 1】

【表 1 5 1】

D462			
D463			
D464			
D465			
D466			
D467			
D468			
D469			
D470			
D471			
D472			
D473			
D474			
D475			
D476			

10

20

30

40

【表 1 5 2】

D477			
D478			
D479			
D480			
D481			
D482			
D483			
D484			
D485			
D486			
D487			
D488			
D489			
D490			

10

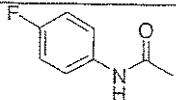
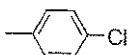
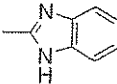
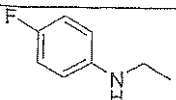
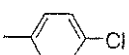
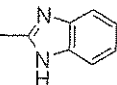
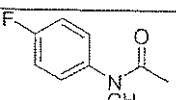
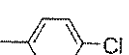
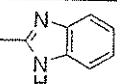
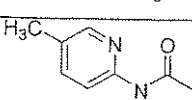
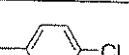
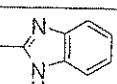
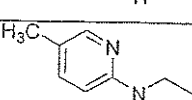
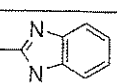
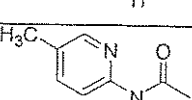
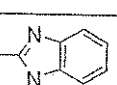
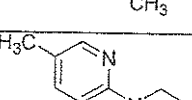
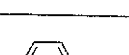
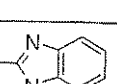
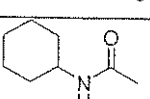
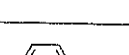
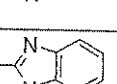
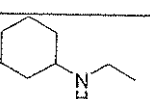
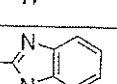
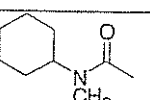
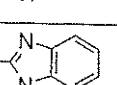
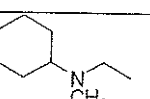
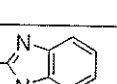
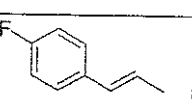
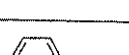
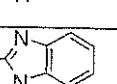
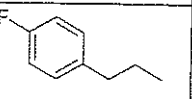
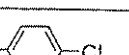
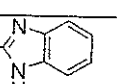
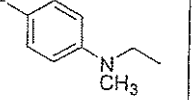
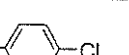
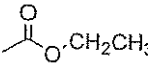
20

30

40

【0 2 0 3】

【表 1 5 3】

D491			
D492			
D493			
D494			
D495			
D496			
D497			
D498			
D499			
D500			
D501			
D502			
D503			
D504			

10

20

30

40

【0 2 0 4】

【表 1 5 4】

D505			
D506			
D507			
D508			
D509			
D510			
D511			
D512			
D513			
D514			
D515			
D516			
D517			

10

20

30

40

【0 2 0 5】

【表 1 5 5】

D518			
D519			
D520			
D521			
D522			
D523			
D524			
D525			
D526			
D527			
D528			
D529			
D530			

10

20

30

40

【0 2 0 6】

【表 1 5 6】

D531			
D532			
D533			
D534			
D535			
D536			
D537			
D538			
D539			
D540			
D541			
D542			
D543			

10

20

30

40

【表 1 5 7】

D544			
D545			
D546			
D547			
D548			
D549			
D550			
D551			
D552			
D553			
D554			
D555			
D556			
D557			

10

20

30

40

【表 1 5 8】

D558			
D559			
D560			
D561			
D562			
D563			
D564			
D565			
D566			
D567			
D568			
D569			
D570			
D571			

10

20

30

40

【表 1 5 9】

D572			
D573			
D574			
D575		CH ₃	
D576			
D577			
D578			
D579			
D580		CH ₃	
D581			
D582			

10

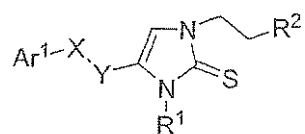
20

30

【 0 2 1 0 】

【表 1 6 0】

表 D-6



Cpd no.	Ar¹-X-Y	R¹	R²
D583			
D584			
D585			
D586			
D587			
D588			
D589			
D590			
D591			
D592			
D593			
D594			

10

20

30

40

【0 2 1 1】

【表 1 6 1】

D595			
D596			
D597			
D598			
D599			
D600			
D601			
D602			
D603			
D604			
D605			
D606			
D607			
D608			
D609			

10

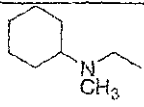
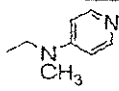
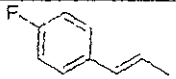
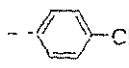
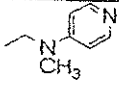
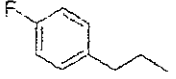
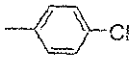
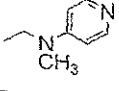
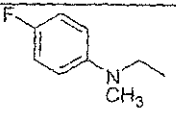
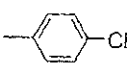
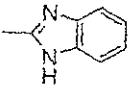
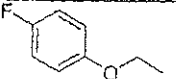
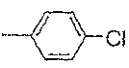
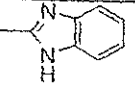
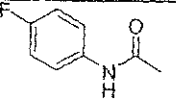
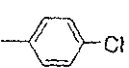
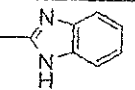
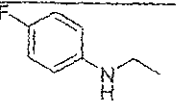
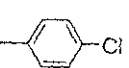
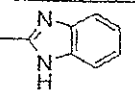
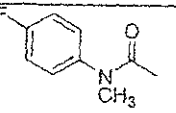
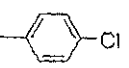
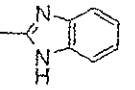
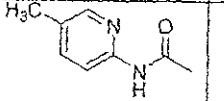
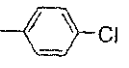
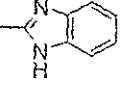
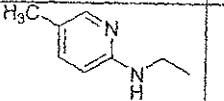
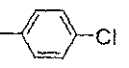
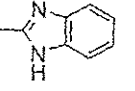
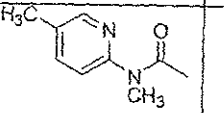
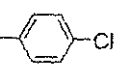
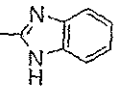
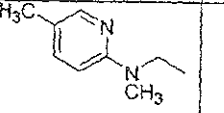
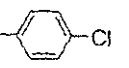
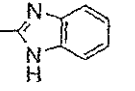
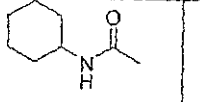
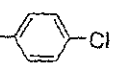
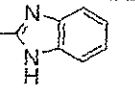
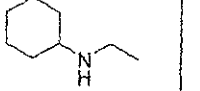
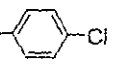
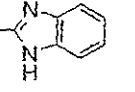
20

30

40

【0 2 1 2】

【表 1 6 2】

D610			
D611			
D612			
D613			
D614			
D615			
D616			
D617			
D618			
D619			
D620			
D621			
D622			
D623			

10

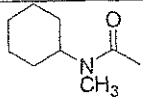
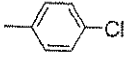
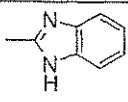
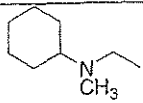
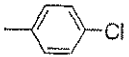
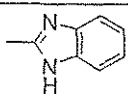
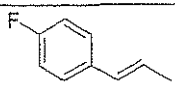
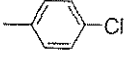
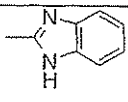
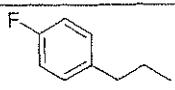
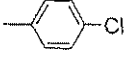
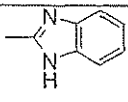
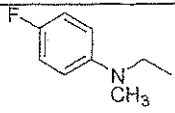
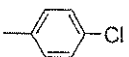
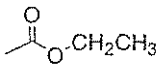
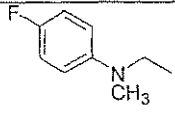
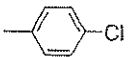
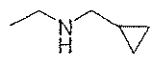
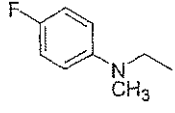
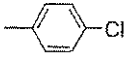
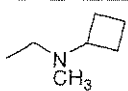
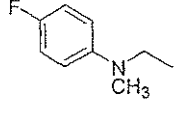
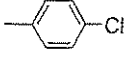
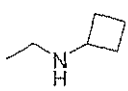
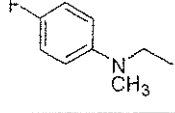
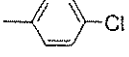
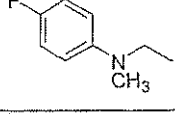
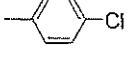
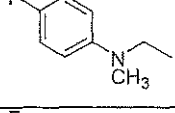
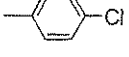
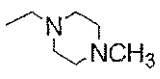
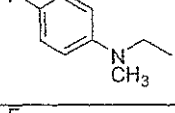
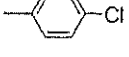
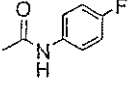
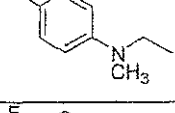
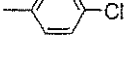
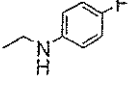
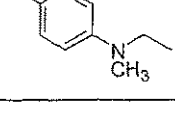
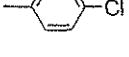
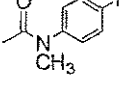
20

30

40

【0 2 1 3】

【表 1 6 3】

D624			
D625			
D626			
D627			
D628			
D629			
D630			
D631			
D632			
D633			
D634			
D635			
D636			
D637			

10

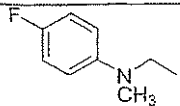
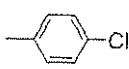
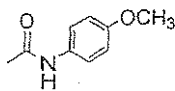
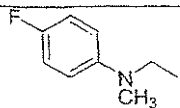
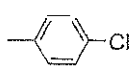
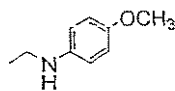
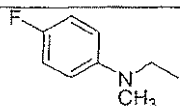
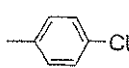
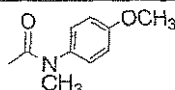
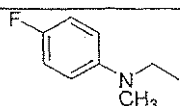
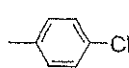
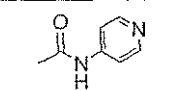
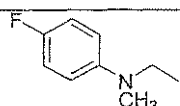
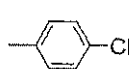
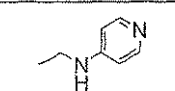
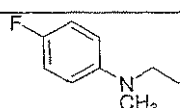
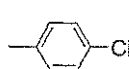
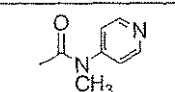
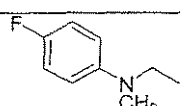
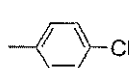
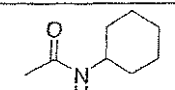
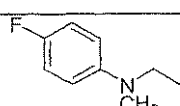
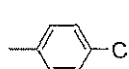
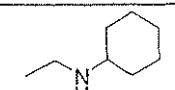
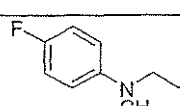
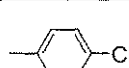
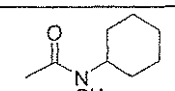
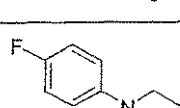
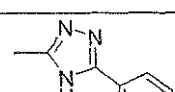
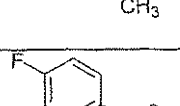
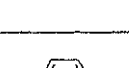
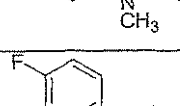
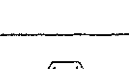
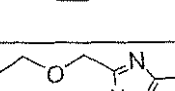
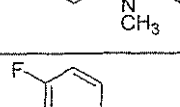
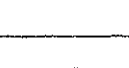
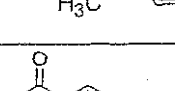
20

30

40

【0 2 1 4】

【表 1 6 4】

D638			
D639			
D640			
D641			
D642			
D643			
D644			
D645			
D646			
D647			
D648			
D649			
D650			

10

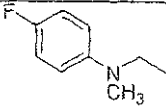
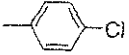
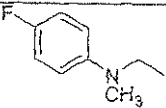
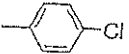
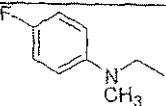
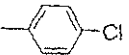
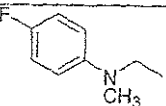
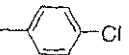
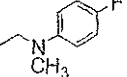
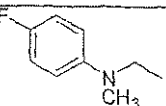
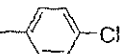
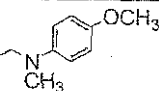
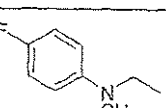
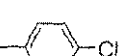
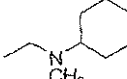
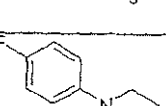
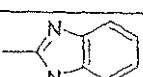
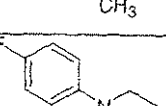
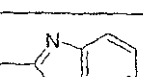
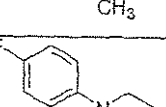
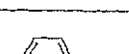
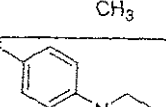
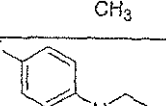
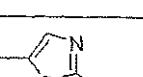
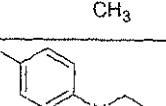
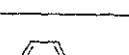
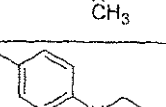
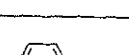
20

30

40

【0 2 1 5】

【表 1 6 5】

D651			
D652			
D653			
D654			
D655			
D656			
D657			
D658			
D659			
D660			
D661			
D662			
D663			

10

20

30

40

【0 2 1 6】

【表 1 6 6】

D664			
D665			
D666			
D667			
D668			
D669			
D670			
D671			
D672			
D673			
D674			
D675			
D676			

10

20

30

40

【 0 2 1 7 】

【表 1 6 7】

D677			
D678			
D679			
D680			
D681			
D682			
D683			
D684			
D685			
D686			
D687			
D688			
D689			
D690			
D691			

10

20

30

40

【0 2 1 8】

【表 1 6 8】

D692			
D693		CH ₃	
D694			
D695			
D696			
D697			
D698			
D699		CH ₃	
D700			
D701			
D702			
D703			
D704		CH ₃	
D705			
D706			

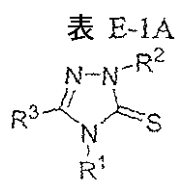
10

20

30

40

【表 1 6 9】



Cpd No.	R ³	R ¹	R ²
E1			
E2			
E3			
E4			
E5			
E6			
E7	H ₃ C-		
E8			
E9			
E10			
E11			

10

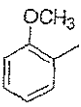
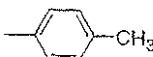
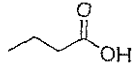
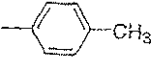
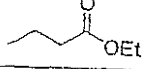
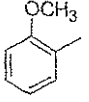
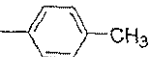
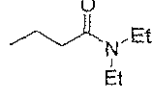
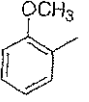
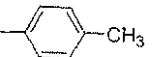
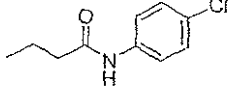
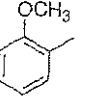
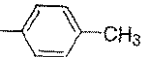
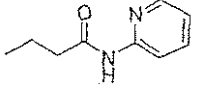
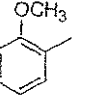
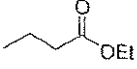
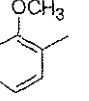
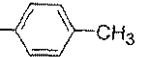
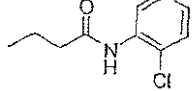
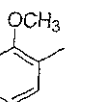
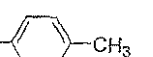
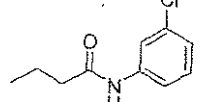
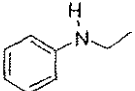
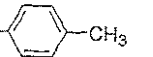
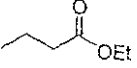
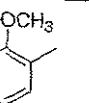
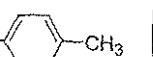
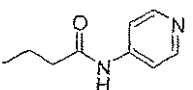
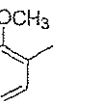
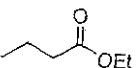
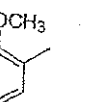
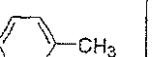
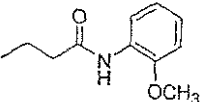
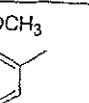
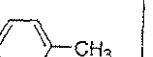
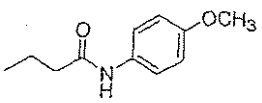
20

30

40

【 0 2 2 0 】

【表 170】

E12			
E13			
E14			
E15			
E16			
E17			
E18			
E19			
E20			
E21			
E22		CH_3	
E23			
E24			

10

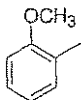
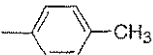
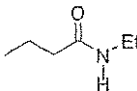
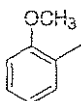
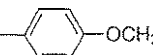
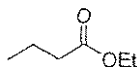
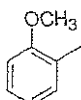
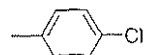
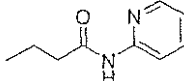
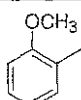
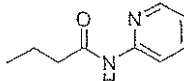
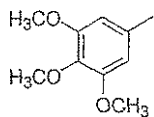
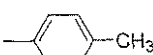
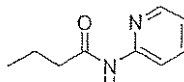
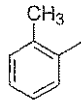
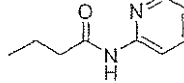
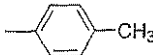
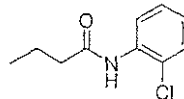
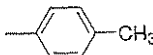
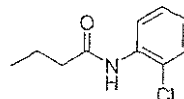
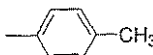
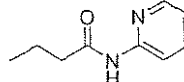
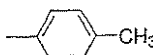
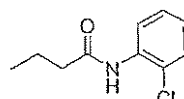
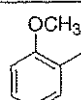
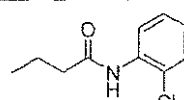
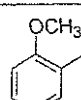
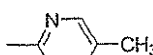
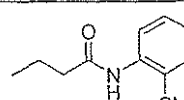
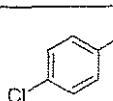
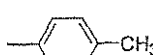
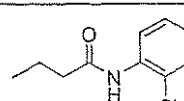
20

30

40

【0221】

【表 1 7 1】

E25			
E26			
E27			
E28			
E29			
E30			
E31			
E32			
E33			
E34			
E35		i-Pr	
E36			
E37			

10

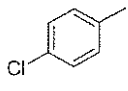
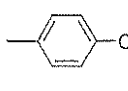
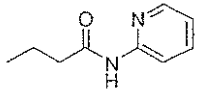
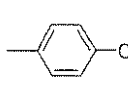
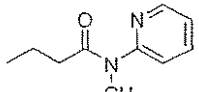
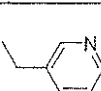
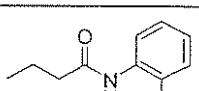
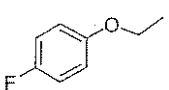
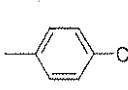
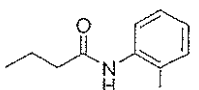
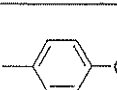
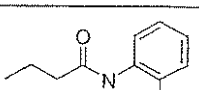
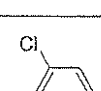
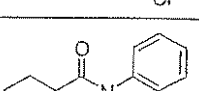
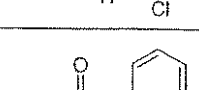
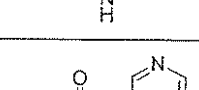
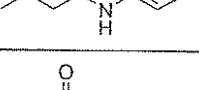
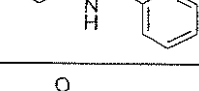
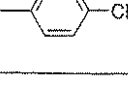
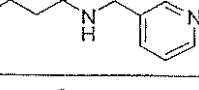
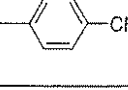
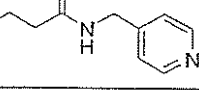
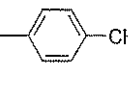
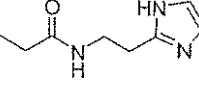
20

30

40

【0 2 2 2】

【表 1 7 2】

E38			
E39			
E40			
E41			
E42			
E43			
E44			
E45			
E46			
E47			
E48			
E49			
E50			

10

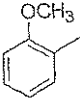
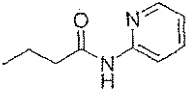
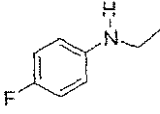
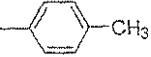
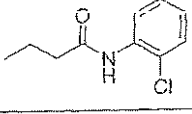
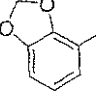
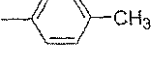
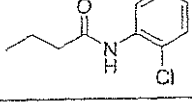
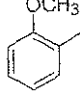
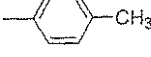
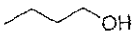
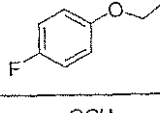
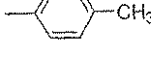
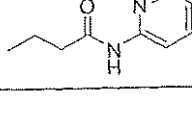
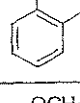
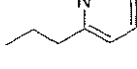
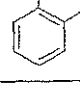
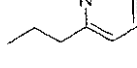
20

30

40

【0 2 2 3】

【表 1 7 3】

E51		i-Pr	
E52			
E53			
E54			
E55			
E56			
E57			

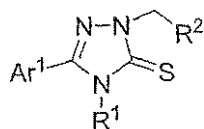
10

20

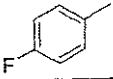
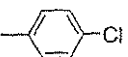
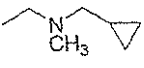
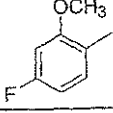
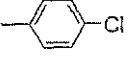
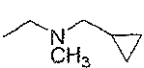
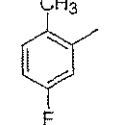
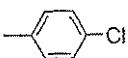
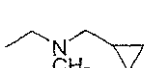
【0 2 2 4】

【表 1 7 4】

表 E-1B



30

Cpd no.	Ar ¹	R ¹	R ²
E58			
E59			
E60			

40

【0 2 2 5】

【表 1 7 5】

E61			
E62			
E63			
E64			
E65			
E66			
E67			
E68			
E69			
E70			
E71			
E72			
E73			
E74			

10

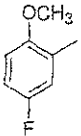
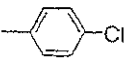
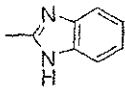
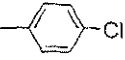
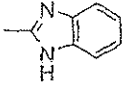
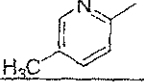
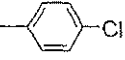
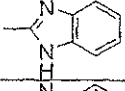
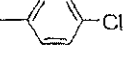
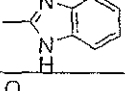
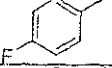
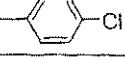
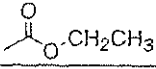
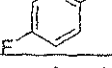
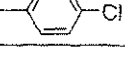
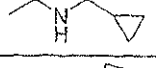
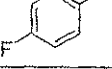
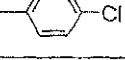
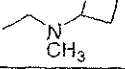
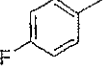
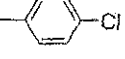
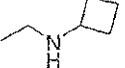
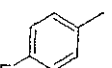
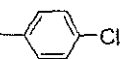
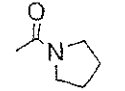
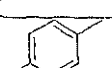
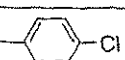
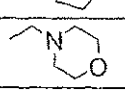
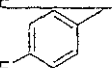
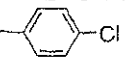
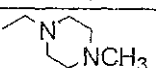
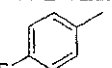
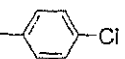
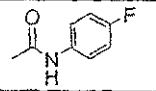
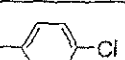
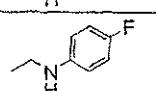
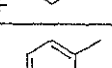
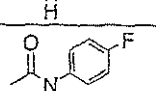
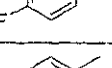
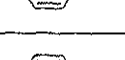
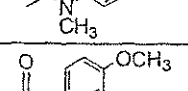
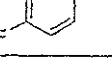
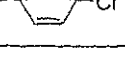
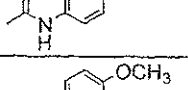
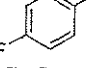
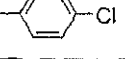
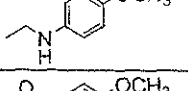
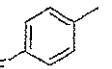
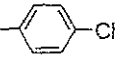
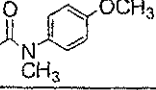
20

30

40

【0 2 2 6】

【表 1 7 6】

E75			
E76			
E77			
E78			
E79			
E80			
E81			
E82			
E83			
E84			
E85			
E86			
E87			
E88			
E89			
E90			
E91			
E92			

10

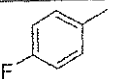
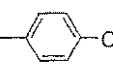
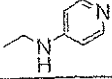
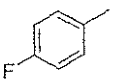
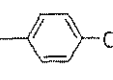
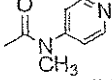
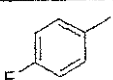
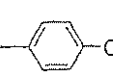
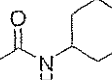
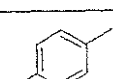
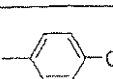
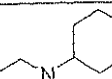
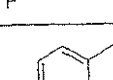
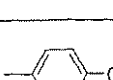
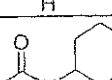
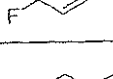
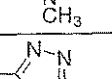
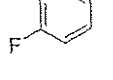
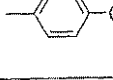
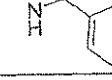
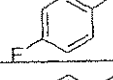
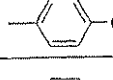
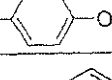
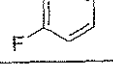
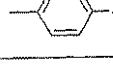
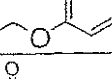
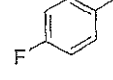
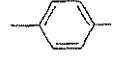
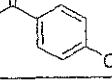
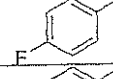
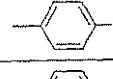
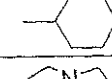
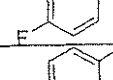
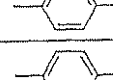
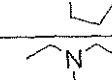
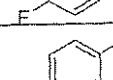
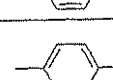
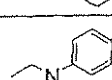
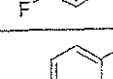
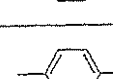
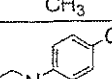
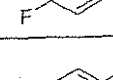
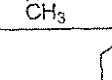
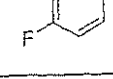
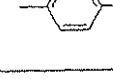
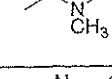
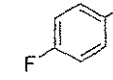
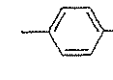
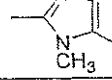
20

30

40

【0 2 2 7】

【表 1 7 7】

E93			
E94			
E95			
E96			
E97			
E98			
E99			
E100			
E101			
E102			
E103			
E104			
E105			
E106			
E107			
E108			
E109			

10

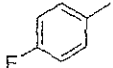
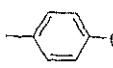
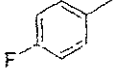
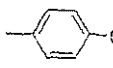
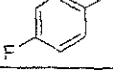
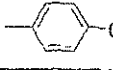
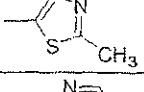
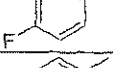
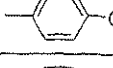
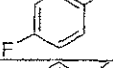
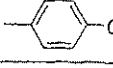
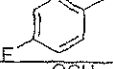
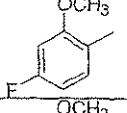
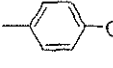
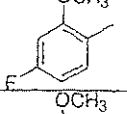
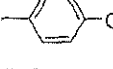
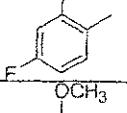
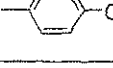
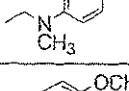
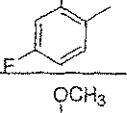
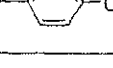
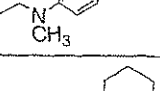
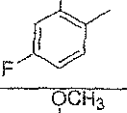
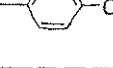
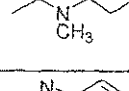
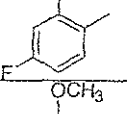
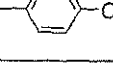
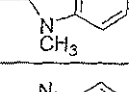
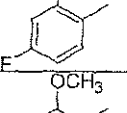
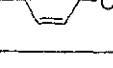
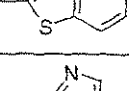
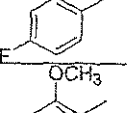
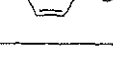
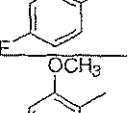
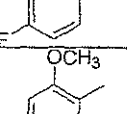
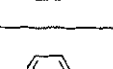
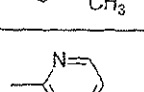
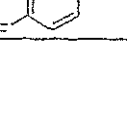
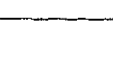
20

30

40

【0 2 2 8】

【表 178】

E110			
E111			
E112			
E113			
E114			
E115			
E116			
E117			
E118			
E119			
E120			
E121			
E122			
E123			
E124			
E125			
E126			

10

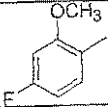
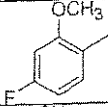
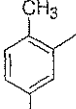
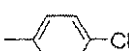
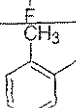
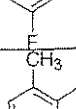
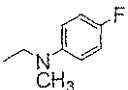
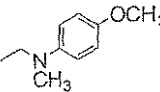
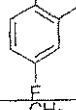
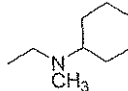
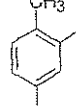
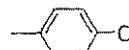
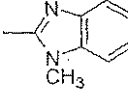
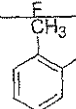
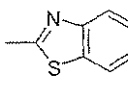
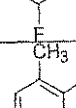
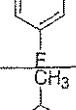
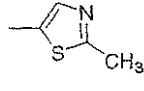
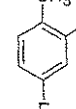
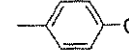
20

30

40

【0229】

【表 1 7 9】

E127			
E128			
E129			
E130			
E131			
E132			
E133			
E134			
E135			
E136			
E137			
E138			
E139			

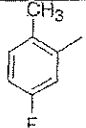
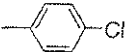
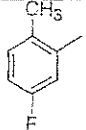
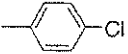
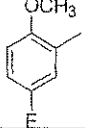
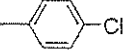
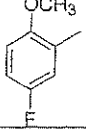
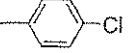
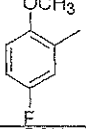
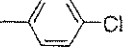
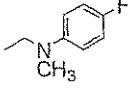
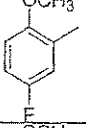
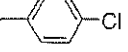
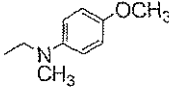
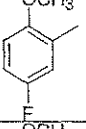
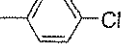
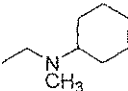
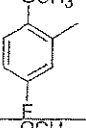
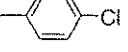
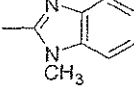
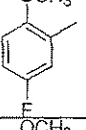
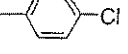
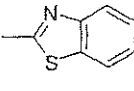
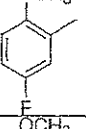
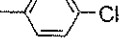
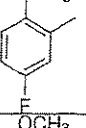
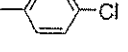
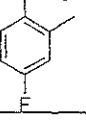
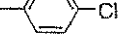
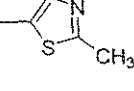
10

20

30

40

【表 180】

E140			
E141			
E142			
E143			
E144			
E145			
E146			
E147			
E148			
E149			
E150			
E151			

10

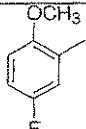
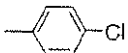
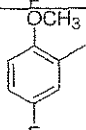
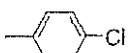
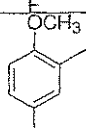
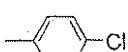
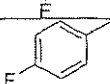
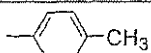
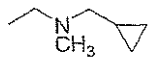
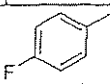
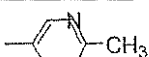
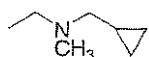
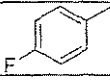
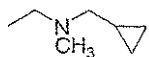
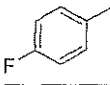
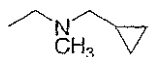
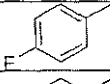
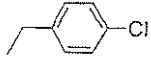
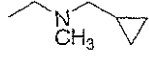
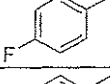
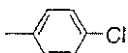
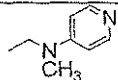
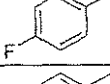
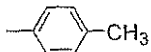
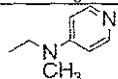
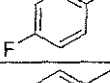
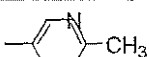
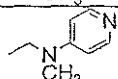
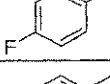
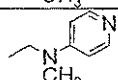
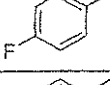
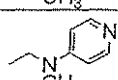
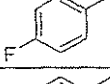
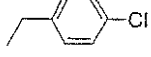
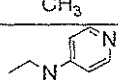
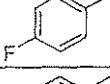
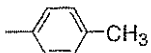
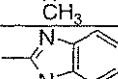
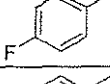
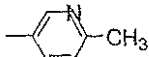
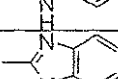
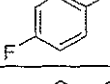
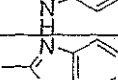
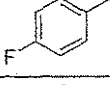
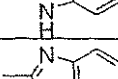
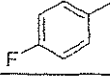
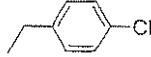
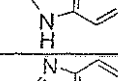
20

30

40

【0231】

【表 181】

E152			
E153			
E154			
E155			
E156			
E157			
E158			
E159			
E160			
E161			
E162			
E163			
E164			
E165			
E166			
E167			
E168			
E169			
E170			

10

20

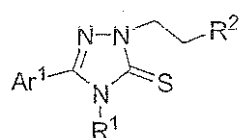
30

40

【0232】

【表 182】

表 E-1C



Cpd no.	Ar ¹	ER ¹	R ²
E171		E	
E172			
E173			
E174			
E175			
E176			
E177			
E178			
E179			
E180			

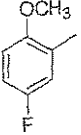
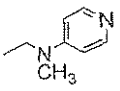
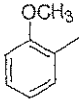
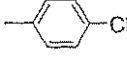
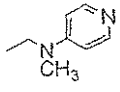
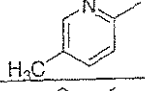
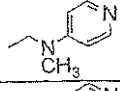
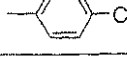
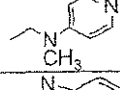
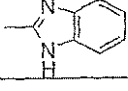
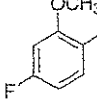
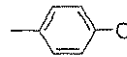
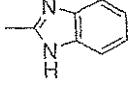
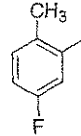
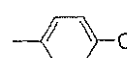
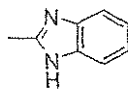
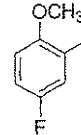
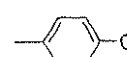
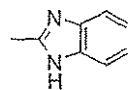
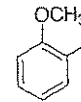
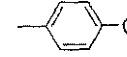
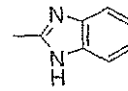
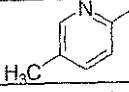
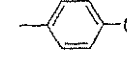
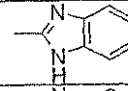
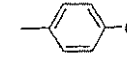
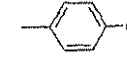
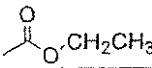
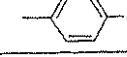
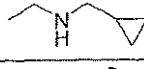
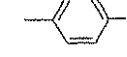
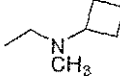
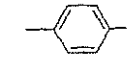
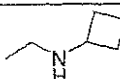
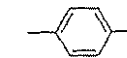
10

20

30

【0233】

【表 183】

E181			
E182			
E183			
E184			
E185			
E186			
E187			
E188			
E189			
E190			
E191			
E192			
E193			
E194			
E195			
E196			

10

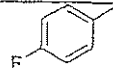
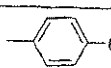
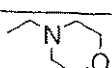
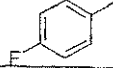
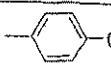
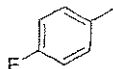
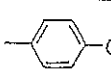
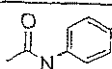
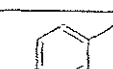
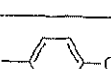
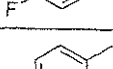
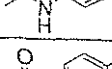
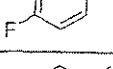
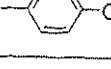
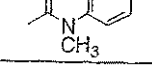
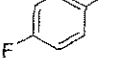
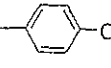
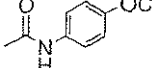
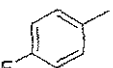
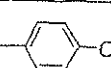
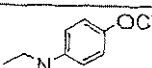
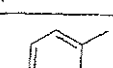
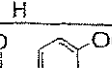
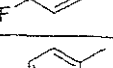
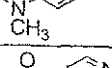
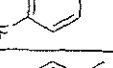
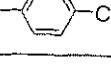
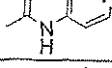
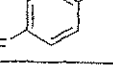
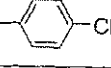
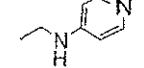
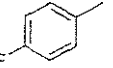
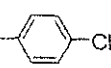
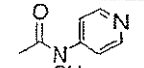
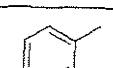
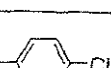
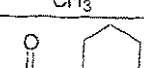
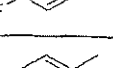
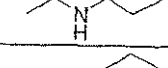
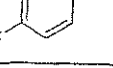
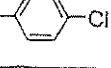
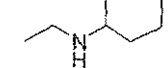
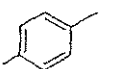
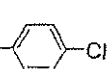
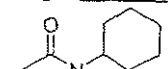
20

30

40

【0234】

【表 184】

E197			
E198			
E199			
E200			
E201			
E202			
E203			
E204			
E205			
E206			
E207			
E208			
E209			
E210			
E211			
E212			
E213			

10

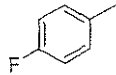
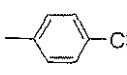
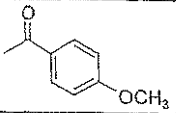
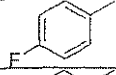
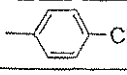
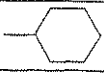
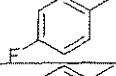
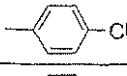
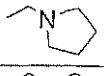
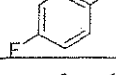
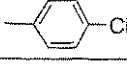
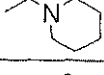
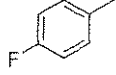
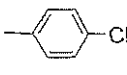
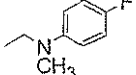
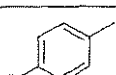
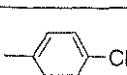
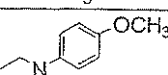
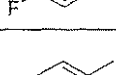
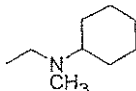
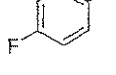
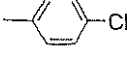
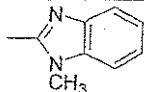
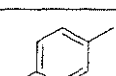
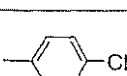
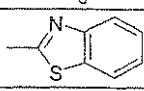
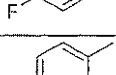
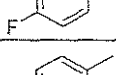
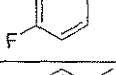
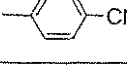
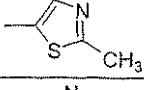
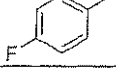
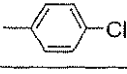
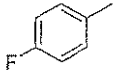
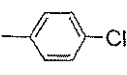
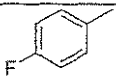
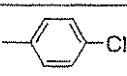
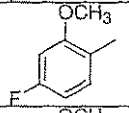
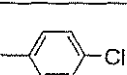
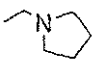
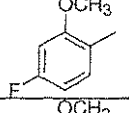
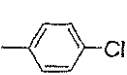
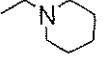
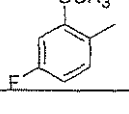
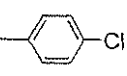
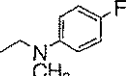
20

30

40

【0235】

【表 185】

E214			
E215			
E216			
E217			
E218			
E219			
E220			
E221			
E222			
E223			
E224			
E225			
E226			
E227			
E228			
E229			
E230			
E231			

10

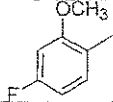
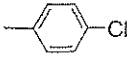
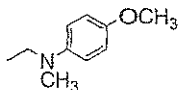
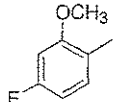
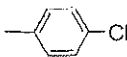
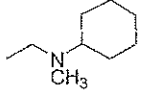
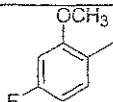
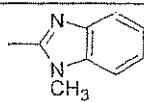
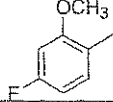
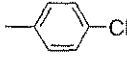
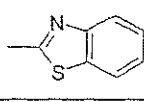
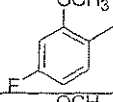
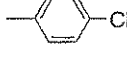
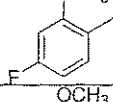
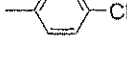
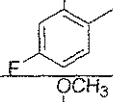
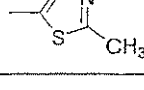
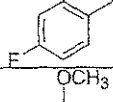
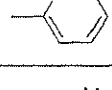
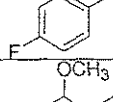
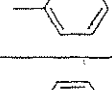
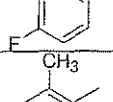
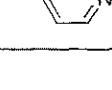
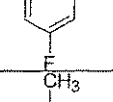
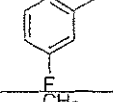
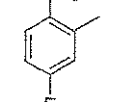
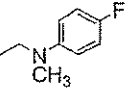
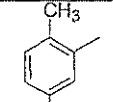
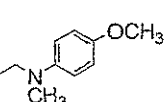
20

30

40

【0236】

【表 186】

E232			
E233			
E234			
E235			
E236			
E237			
E238			
E239			
E240			
E241			
E242			
E243			
E244			
E245			

10

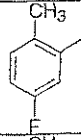
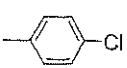
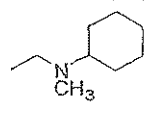
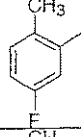
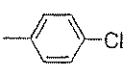
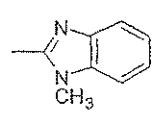
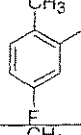
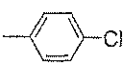
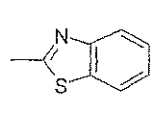
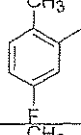
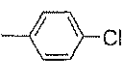
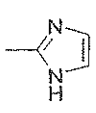
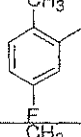
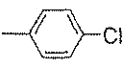
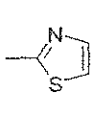
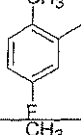
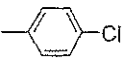
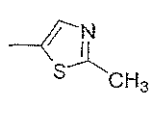
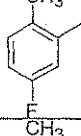
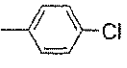
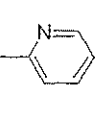
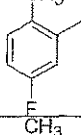
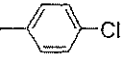
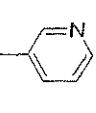
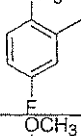
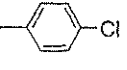
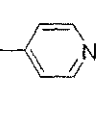
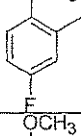
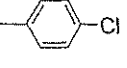
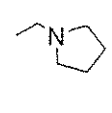
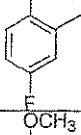
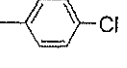
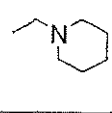
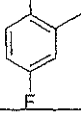
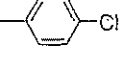
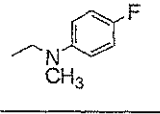
20

30

40

【0237】

【表 187】

E246			
E247			
E248			
E249			
E250			
E251			
E252			
E253			
E254			
E255			
E256			
E257			

10

20

30

40

【0238】

【表 188】

E258			
E259			
E260			
E261			
E262			
E263			
E264			
E265			
E266			
E267			
E268			
E269			
E270			
E271			

【0239】

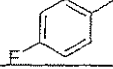
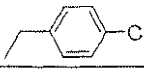
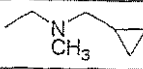
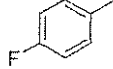
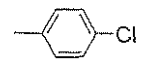
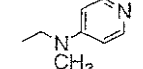
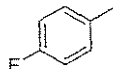
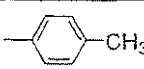
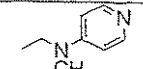
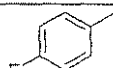
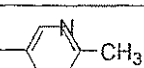
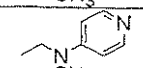
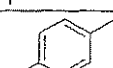
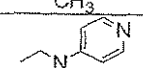
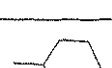
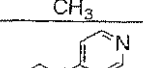
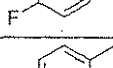
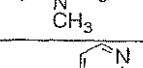
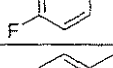
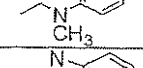
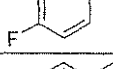
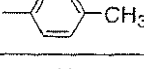
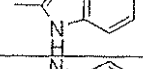
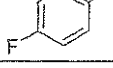
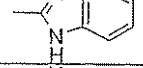
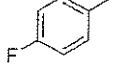
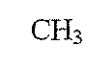
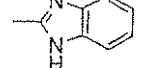
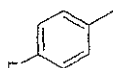
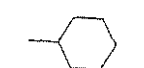
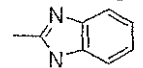
10

20

30

40

【表 189】

E272			
E273			
E274			
E275			
E276		CH ₃	
E277			
E278			
E279			
E280			
E281		CH ₃	
E282			
E283			

10

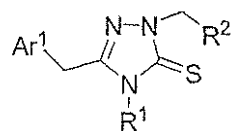
20

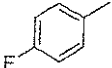
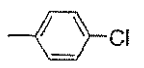
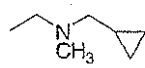
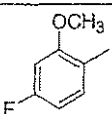
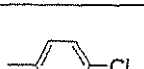
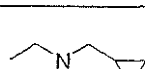
【0240】

30

【表 190】

表 E-1D

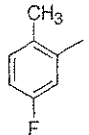
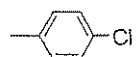
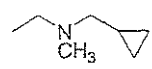
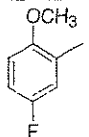
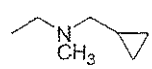
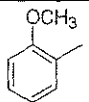
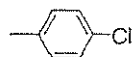
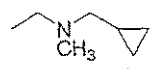
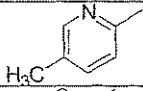
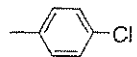
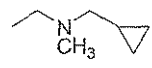
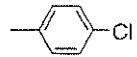
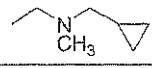
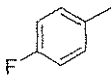
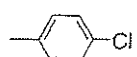
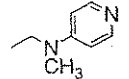
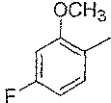
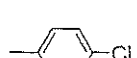
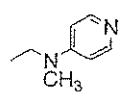
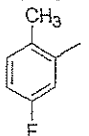
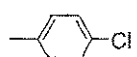
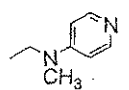
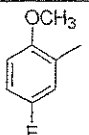
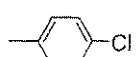
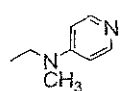
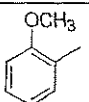
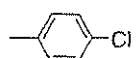
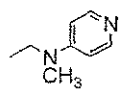
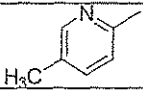
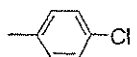
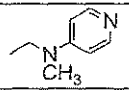
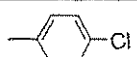
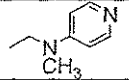
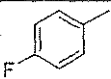
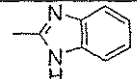
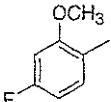
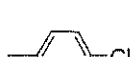
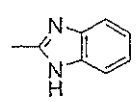


Cpd no.	Ar ¹	R ¹	R ²
E284			
E285			

40

【0241】

【表 191】

E286			
E287			
E288			
E289			
E290			
E291			
E292			
E293			
E294			
E295			
E296			
E297			
E298			
E299			

10

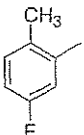
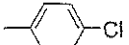
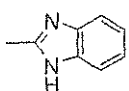
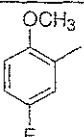
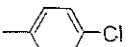
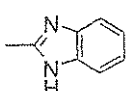
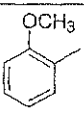
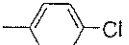
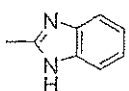
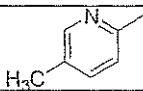
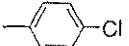
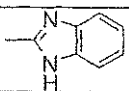
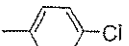
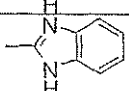
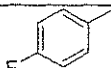
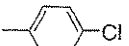
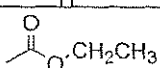
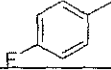
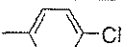
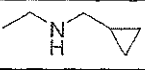
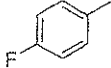
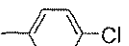
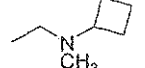
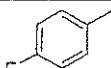
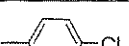
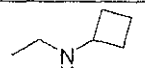
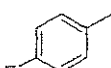
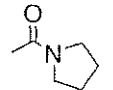
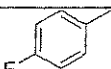
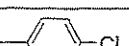
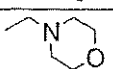
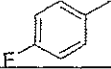
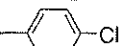
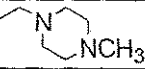
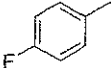
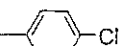
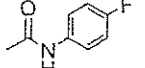
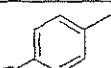
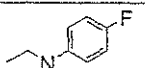
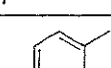
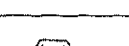
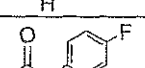
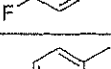
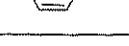
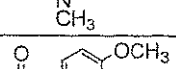
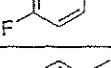
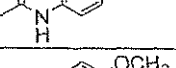
20

30

40

【0242】

【表 1 9 2】

E300			
E301			
E302			
E303			
E304			
E305			
E306			
E307			
E308			
E309			
E310			
E311			
E312			
E313			
E314			
E315			
E316			

10

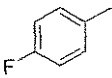
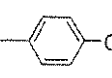
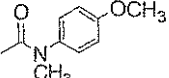
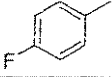
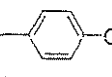
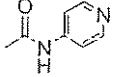
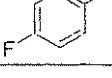
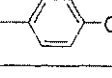
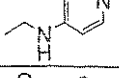
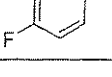
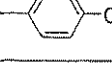
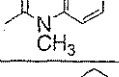
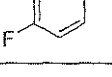
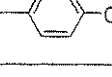
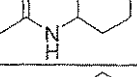
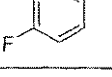
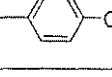
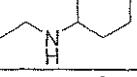
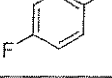
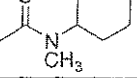
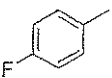
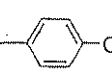
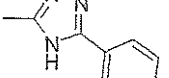
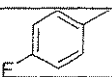
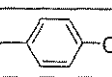
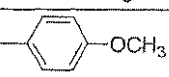
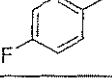
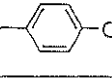
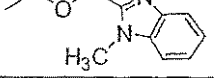
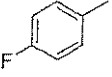
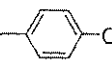
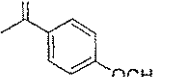
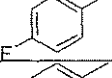
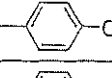
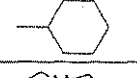
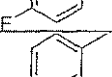
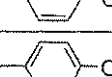
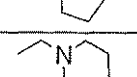
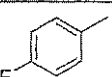
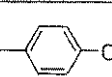
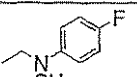
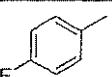
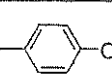
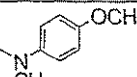
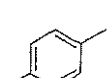
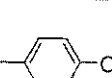
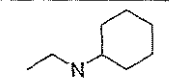
20

30

40

【0 2 4 3】

【表 193】

E317			
E318			
E319			
E320			
E321			
E322			
E323			
E324			
E325			
E326			
E327			
E328			
E329			
E330			
E331			
E332			
E333			

10

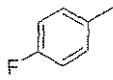
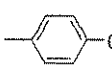
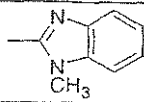
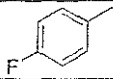
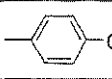
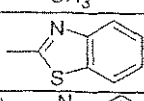
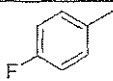
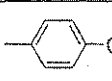
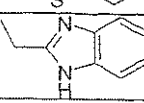
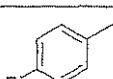
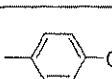
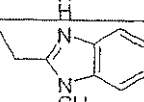
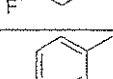
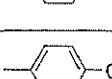
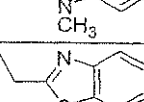
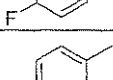
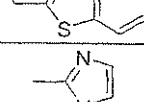
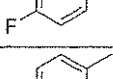
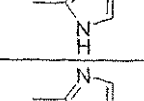
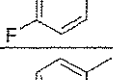
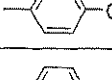
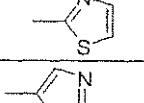
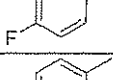
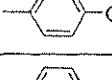
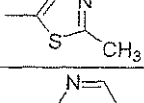
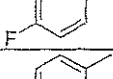
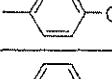
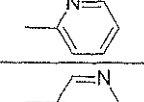
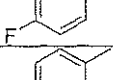
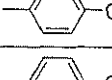
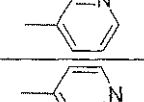
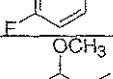
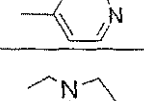
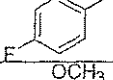
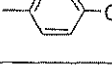
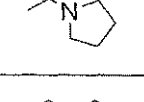
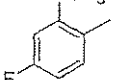
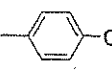
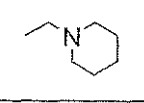
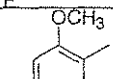
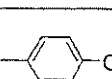
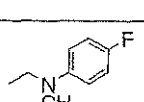
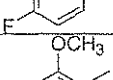
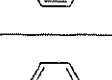
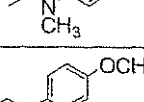
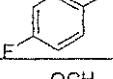
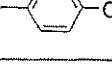
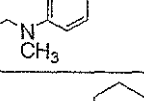
20

30

40

【0244】

【表 194】

E334			
E335			
E336			
E337			
E338			
E339			
E340			
E341			
E342			
E343			
E344			
E345			
E346			
E347			
E348			
E349			
E350			

10

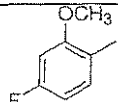
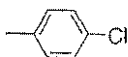
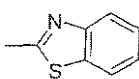
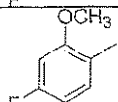
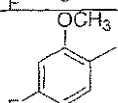
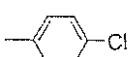
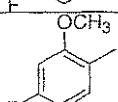
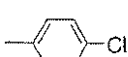
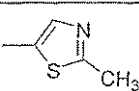
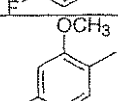
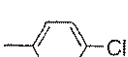
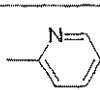
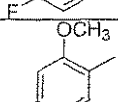
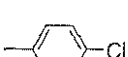
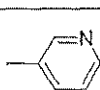
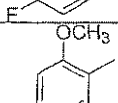
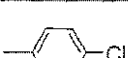
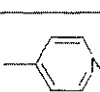
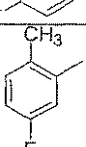
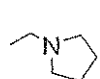
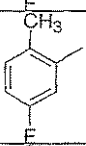
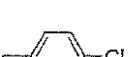
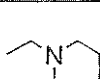
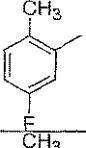
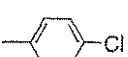
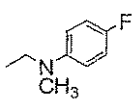
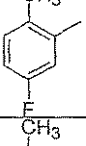
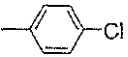
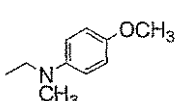
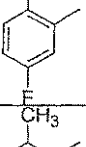
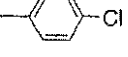
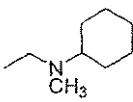
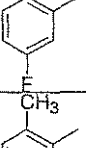
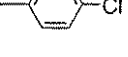
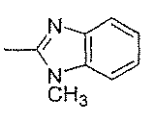
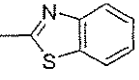
20

30

40

【0245】

【表 195】

E351			
E352			
E353			
E354			
E355			
E356			
E357			
E358			
E359			
E360			
E361			
E362			
E363			
E364			

10

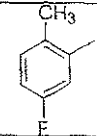
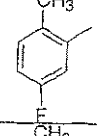
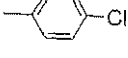
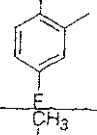
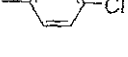
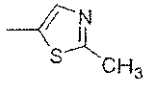
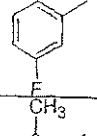
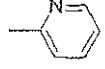
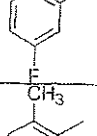
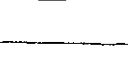
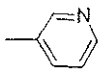
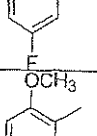
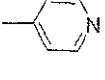
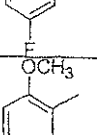
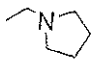
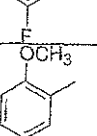
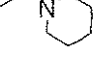
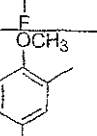
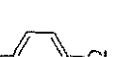
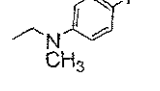
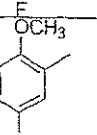
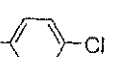
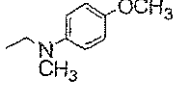
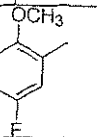
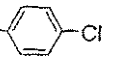
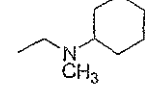
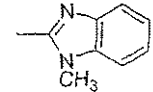
20

30

40

【0246】

【表 196】

E365			
E366			
E367			
E368			
E369			
E370			
E371			
E372			
E373			
E374			
E375			
E376			

10

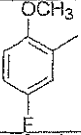
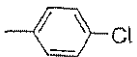
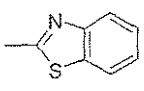
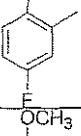
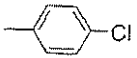
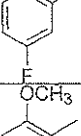
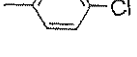
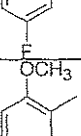
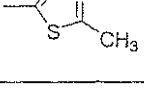
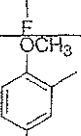
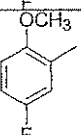
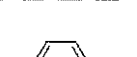
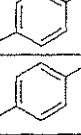
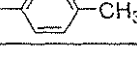
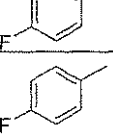
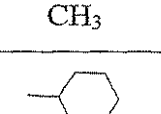
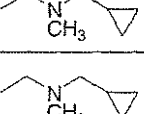
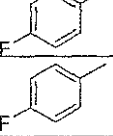
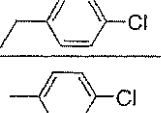
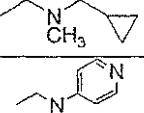
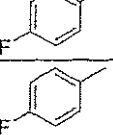
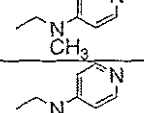
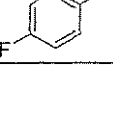
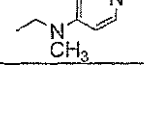
20

30

40

【0247】

【表 197】

E377			
E378			
E379			
E380			
E381			
E382			
E383			
E384			
E385			
E386		CH_3	
E387			
E388			
E389			
E390			
E391			
E392		CH_3	

10

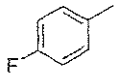
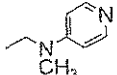
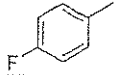
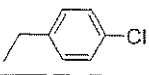
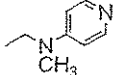
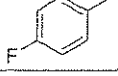
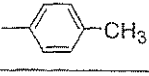
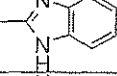
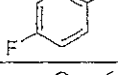
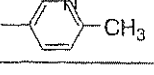
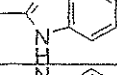
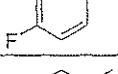
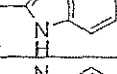
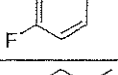
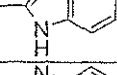
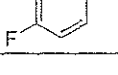
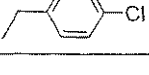
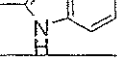
20

30

40

【0248】

【表 198】

E393			
E394			
E395			
E396			
E397		CH ₃	
E398			
E399			

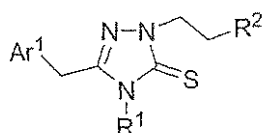
10

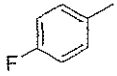
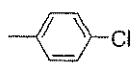
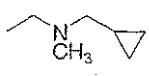
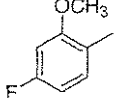
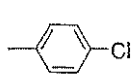
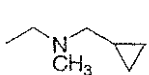
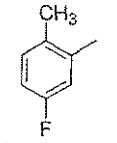
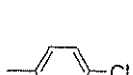
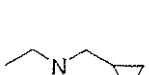
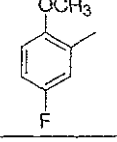
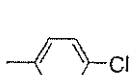
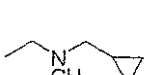
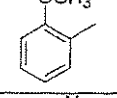
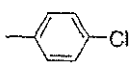
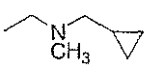
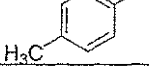
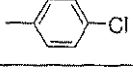
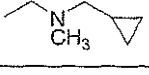
【0249】

20

【表 199】

表 E-1E



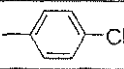
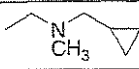
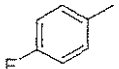
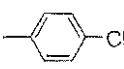
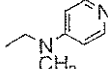
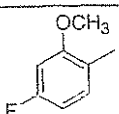
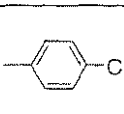
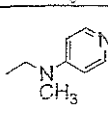
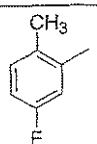
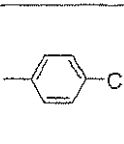
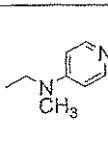
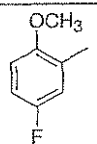
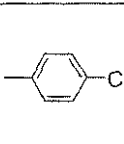
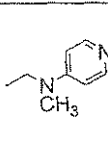
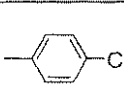
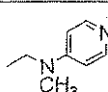
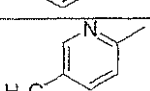
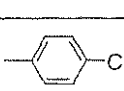
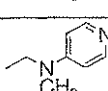
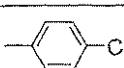
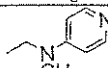
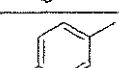
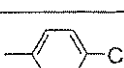
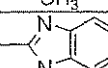
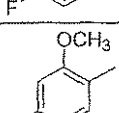
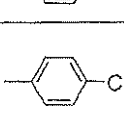
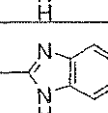
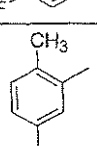
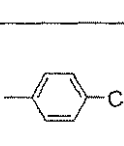
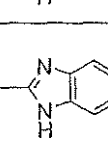
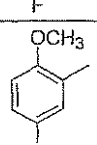
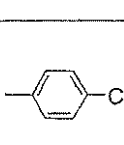
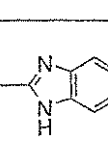
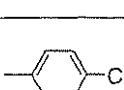
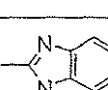
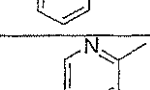
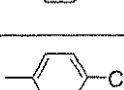
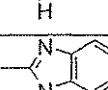
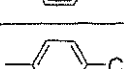
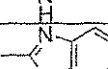
Cpd no.	Ar ¹	R ¹	R ²
E400			
E401			
E402			
E403			
E404			
E405			

30

40

【0250】

【表 2 0 0】

E406			
E407			
E408			
E409			
E410			
E411			
E412			
E413			
E414			
E415			
E416			
E417			
E418			
E419			
E420			

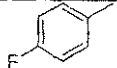
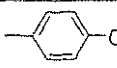
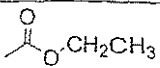
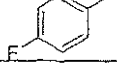
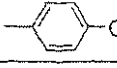
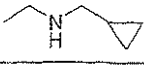
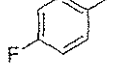
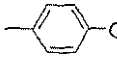
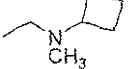
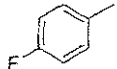
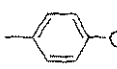
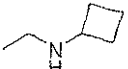
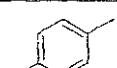
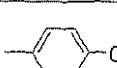
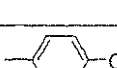
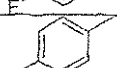
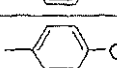
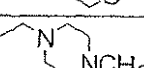
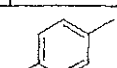
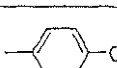
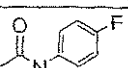
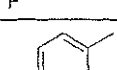
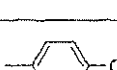
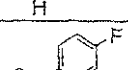
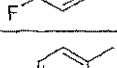
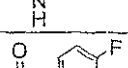
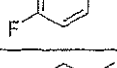
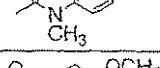
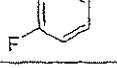
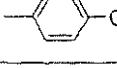
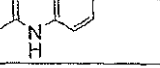
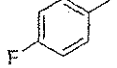
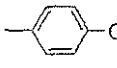
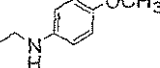
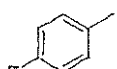
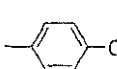
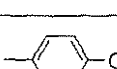
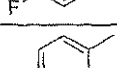
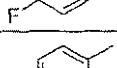
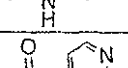
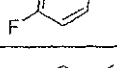
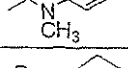
10

20

30

40

【表 2 0 1】

E421			
E422			
E423			
E424			
E425			
E426			
E427			
E428			
E429			
E430			
E431			
E432			
E433			
E434			
E435			
E436			
E437			
E438			

10

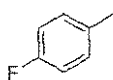
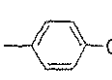
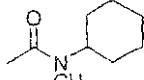
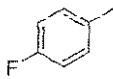
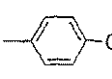
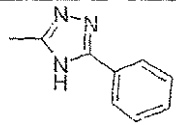
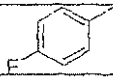
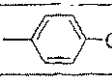
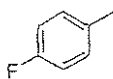
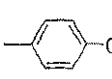
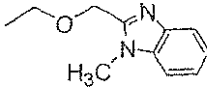
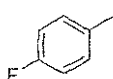
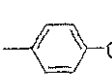
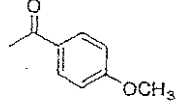
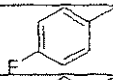
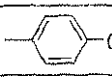
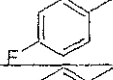
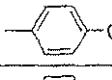
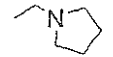
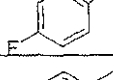
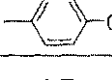
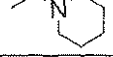
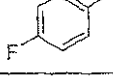
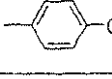
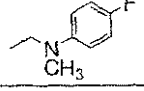
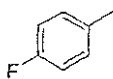
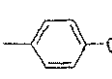
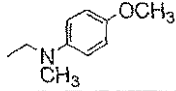
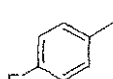
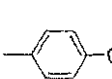
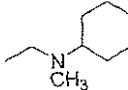
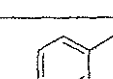
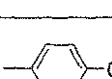
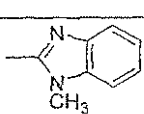
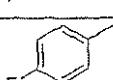
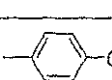
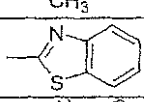
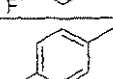
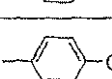
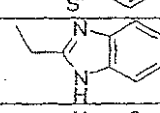
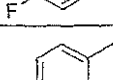
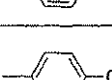
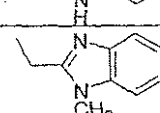
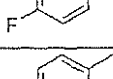
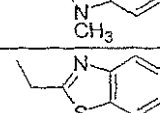
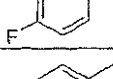
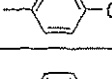
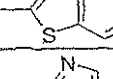
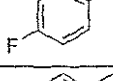
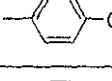
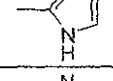
20

30

40

【 0 2 5 2 】

【表 202】

E439			
E440			
E441			
E442			
E443			
E444			
E445			
E446			
E447			
E448			
E449			
E450			
E451			
E452			
E453			
E454			
E455			
E456			

10

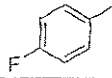
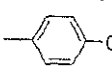
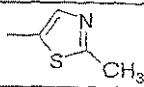
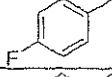
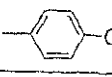
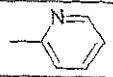
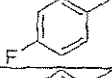
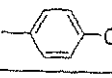
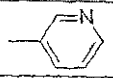
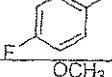
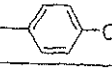
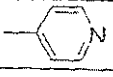
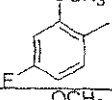
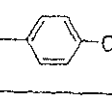
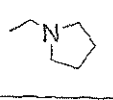
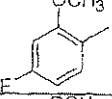
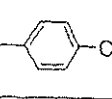
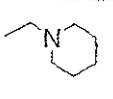
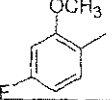
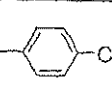
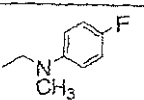
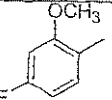
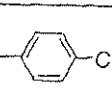
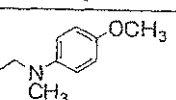
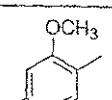
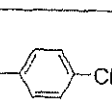
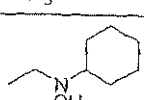
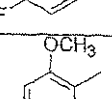
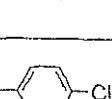
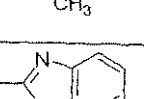
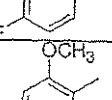
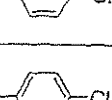
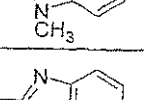
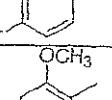
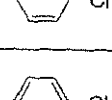
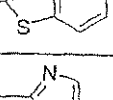
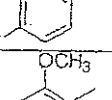
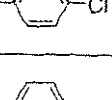
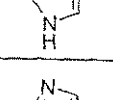
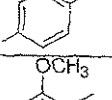
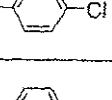
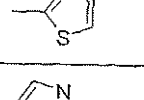
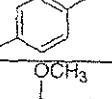
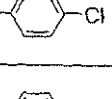
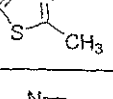
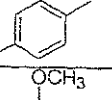
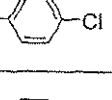
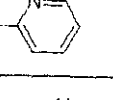
20

30

40

【0253】

【表 203】

E457			
E458			
E459			
E460			
E461			
E462			
E463			
E464			
E465			
E466			
E467			
E468			
E469			
E470			
E471			
E472			

10

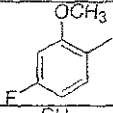
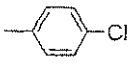
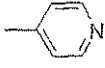
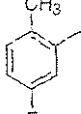
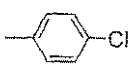
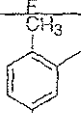
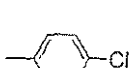
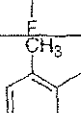
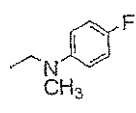
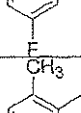
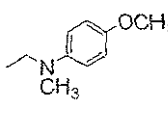
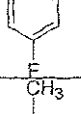
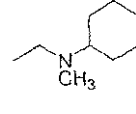
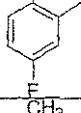
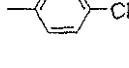
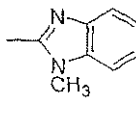
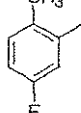
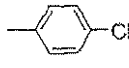
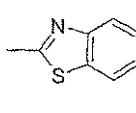
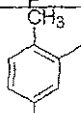
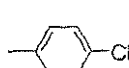
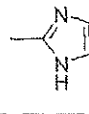
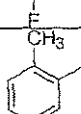
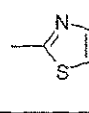
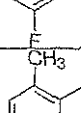
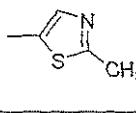
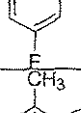
20

30

40

【0254】

【表 204】

E473			
E474			
E475			
E476			
E477			
E478			
E479			
E480			
E481			
E482			
E483			
E484			

10

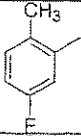
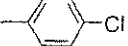
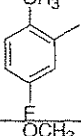
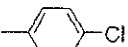
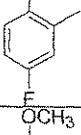
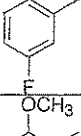
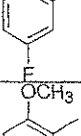
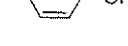
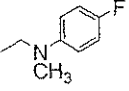
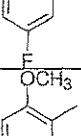
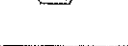
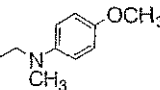
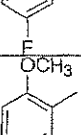
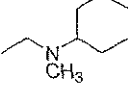
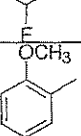
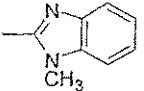
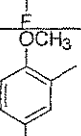
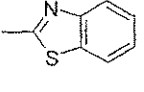
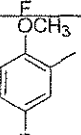
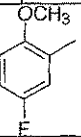
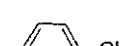
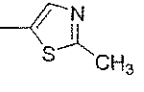
20

30

40

【0255】

【表 205】

E485			
E486			
E487			
E488			
E489			
E490			
E491			
E492			
E493			
E494			
E495			
E496			

10

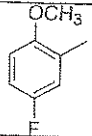
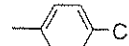
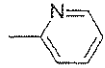
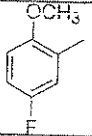
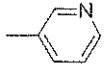
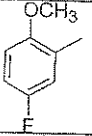
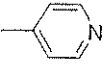
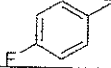
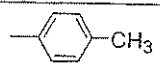
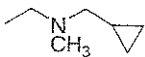
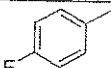
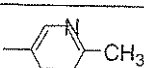
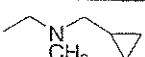
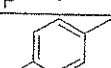
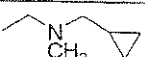
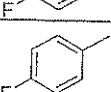
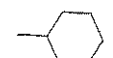
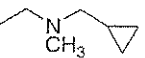
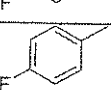
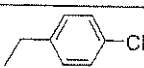
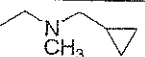
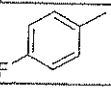
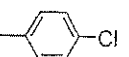
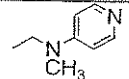
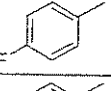
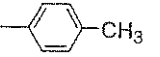
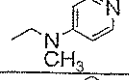
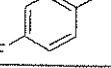
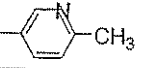
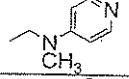
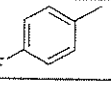
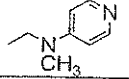
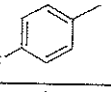
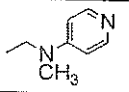
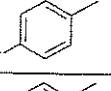
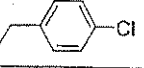
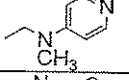
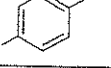
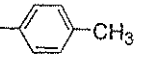
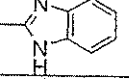
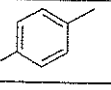
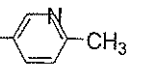
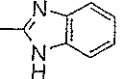
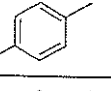
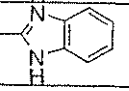
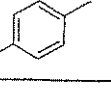
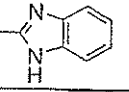
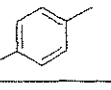
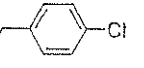
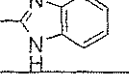
20

30

40

【0256】

【表 2 0 6】

E497			
E498			
E499			
E500			
E501			
E502		CH_3	
E503			
E504			
E505			
E506			
E507			
E508		CH_3	
E509			
E510			
E511			
E512			
E513		CH_3	
E514			
E515			

10

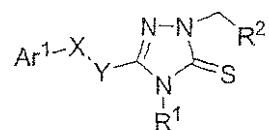
20

30

40

【表 207】

表 E-1F



Cpd. No.	Ar ¹ -X-Y	R ¹	R ²
E516			
E517			
E518			
E519			
E520			
E521			
E522			
E523			
E524			
E525			
E526			
E527			

10

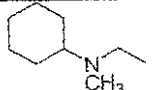
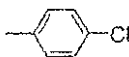
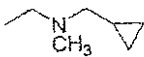
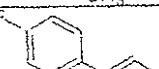
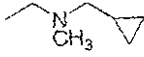
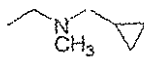
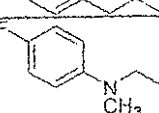
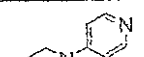
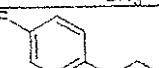
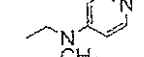
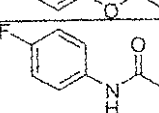
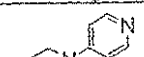
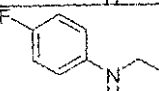
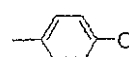
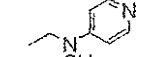
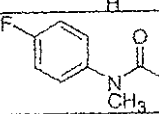
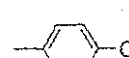
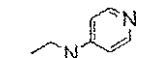
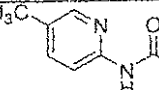
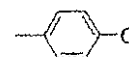
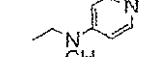
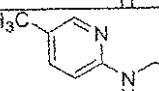
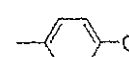
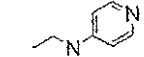
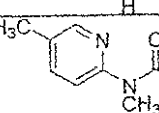
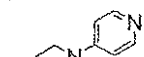
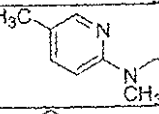
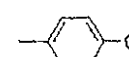
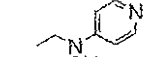
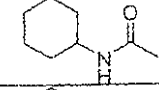
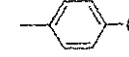
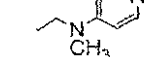
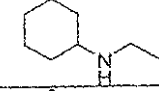
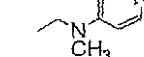
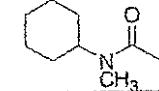
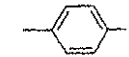
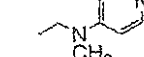
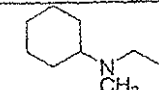
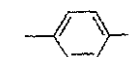
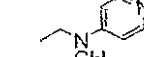
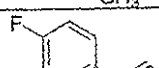
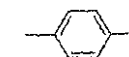
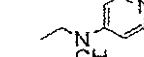
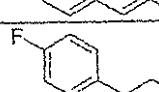
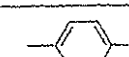
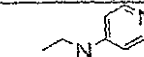
20

30

40

【0258】

【表 208】

E528			
E529			
E530			
E531			
E532			
E533			
E534			
E535			
E536			
E537			
E538			
E539			
E540			
E541			
E542			
E543			
E544			
E545			

10

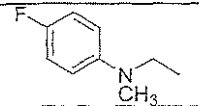
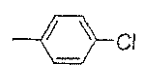
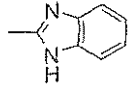
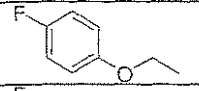
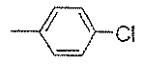
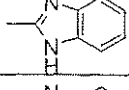
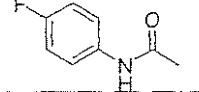
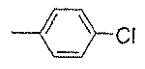
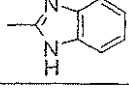
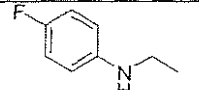
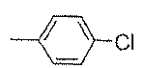
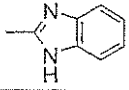
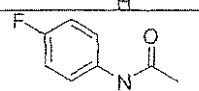
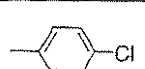
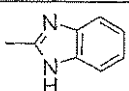
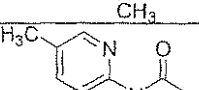
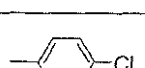
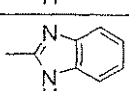
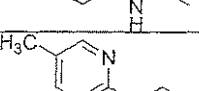
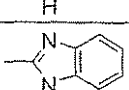
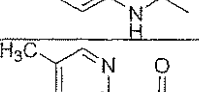
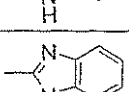
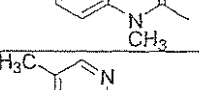
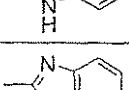
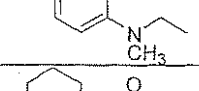
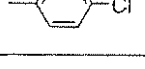
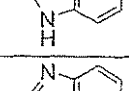
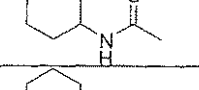
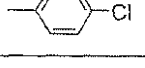
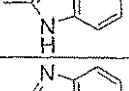
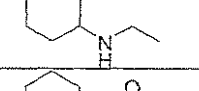
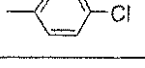
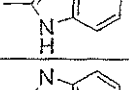
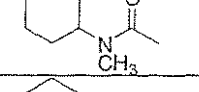
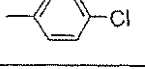
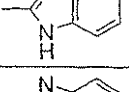
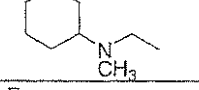
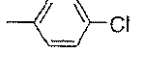
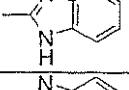
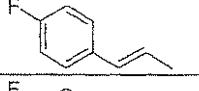
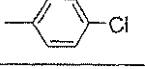
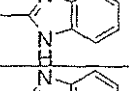
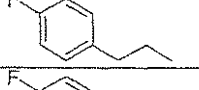
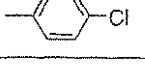
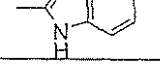
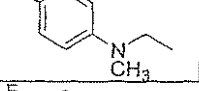
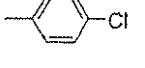
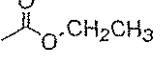
20

30

40

【0259】

【表 209】

E546			
E547			
E548			
E549			
E550			
E551			
E552			
E553			
E554			
E555			
E556			
E557			
E558			
E559			
E560			
E561			
E562			

10

20

30

40

【0260】

【表 2 1 0】

E563			
E564			
E565			
E566			
E567			
E568			
E569			
E570			
E571			
E572			
E573			
E574			
E575			
E576			
E577			
E578			

10

20

30

40

【 0 2 6 1 】

【表 2 1 1】

E579			
E580			
E581			
E582			
E583			
E584			
E585			
E586			
E587			
E588			
E589			
E590			
E591			
E592			
E593			

10

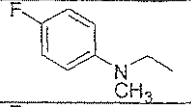
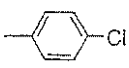
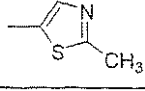
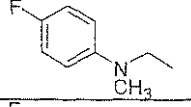
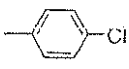
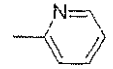
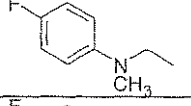
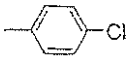
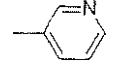
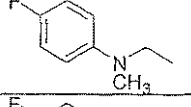
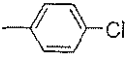
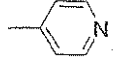
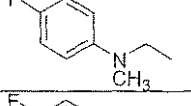
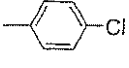
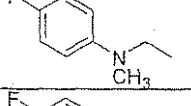
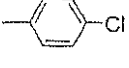
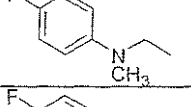
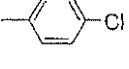
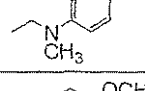
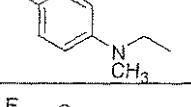
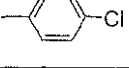
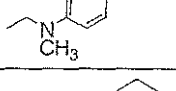
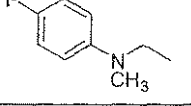
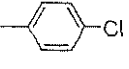
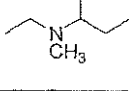
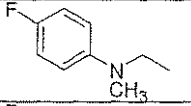
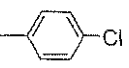
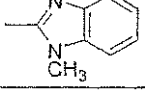
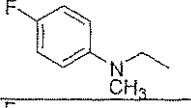
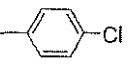
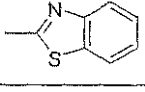
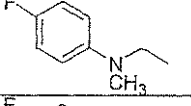
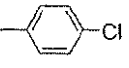
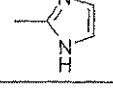
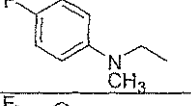
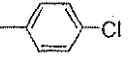
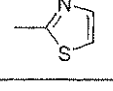
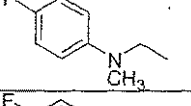
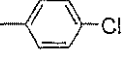
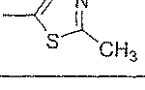
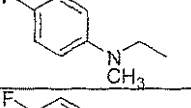
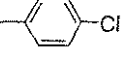
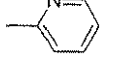
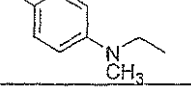
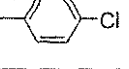
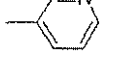
20

30

40

【0 2 6 2】

【表 2 1 2】

E594			
E595			
E596			
E597			
E598			
E599			
E600			
E601			
E602			
E603			
E604			
E605			
E606			
E607			
E608			
E609			

10

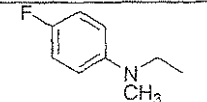
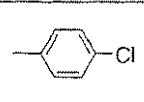
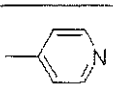
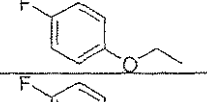
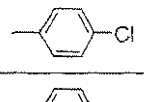
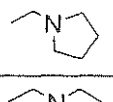
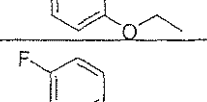
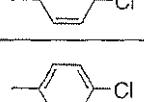
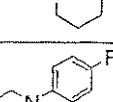
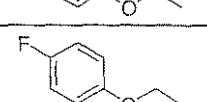
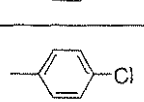
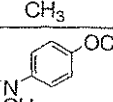
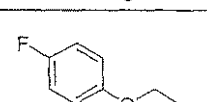
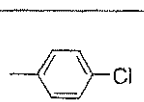
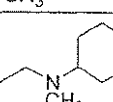
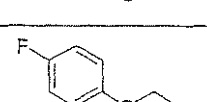
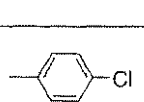
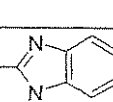
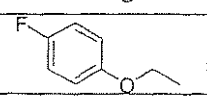
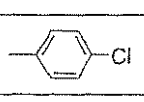
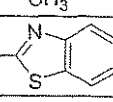
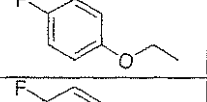
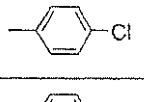
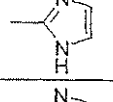
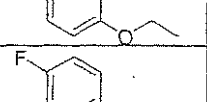
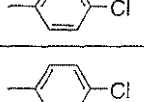
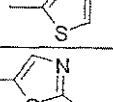
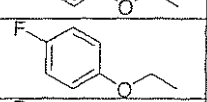
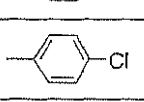
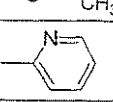
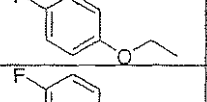
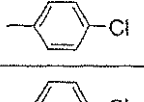
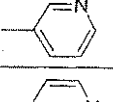
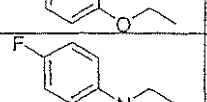
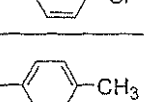
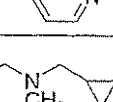
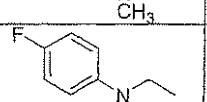
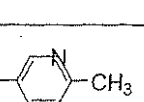
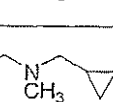
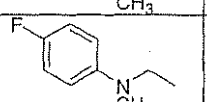
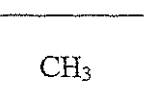
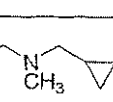
20

30

40

【0 2 6 3】

【表 2 1 3】

E610			
E611			
E612			
E613			
E614			
E615			
E616			
E617			
E618			
E619			
E620			
E621			
E622			
E623			
E624			
E625			
E626		CH_3	

10

20

30

40

【0 2 6 4】

【表 2 1 4】

E627			
E628			
E629			
E630			
E631			
E632		CH ₃	
E633			
E634			
E635			
E636			
E637		CH ₃	
E638			
E639			

10

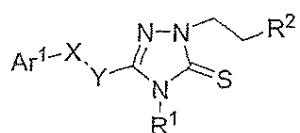
20

30

【0 2 6 5】

【表 2 1 5】

表 E-1G



Cpd. No.	Ar¹-X-Y	R¹	R²
E640			
E641			
E642			
E643			
E644			
E645			
E646			
E647			
E648			
E649			
E650			
E651			
E652			
E653			
E654			
E655			
E656			

10

20

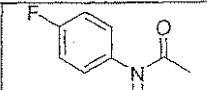
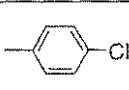
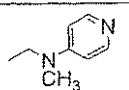
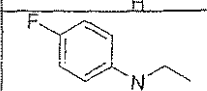
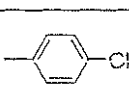
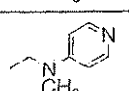
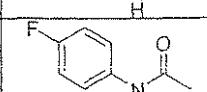
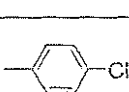
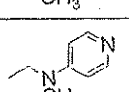
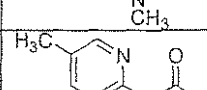
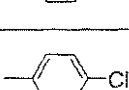
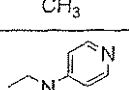
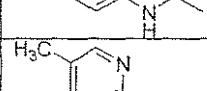
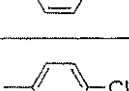
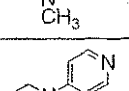
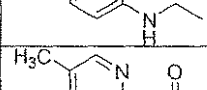
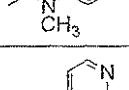
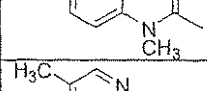
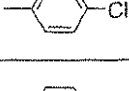
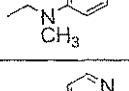
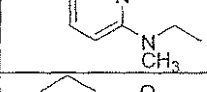
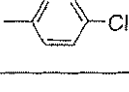
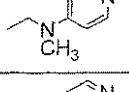
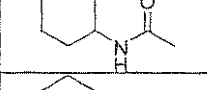
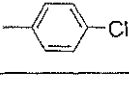
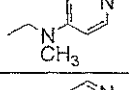
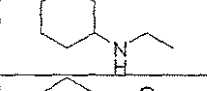
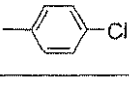
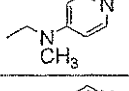
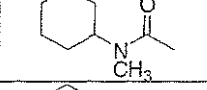
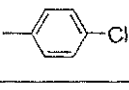
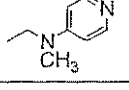
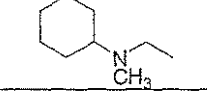
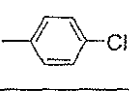
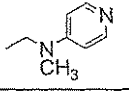
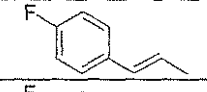
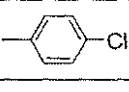
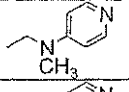
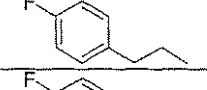
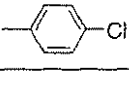
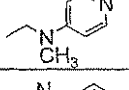
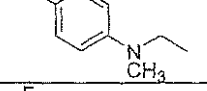
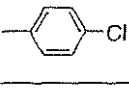
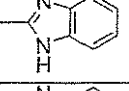
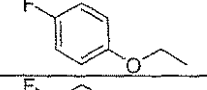
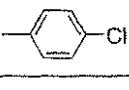
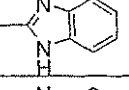
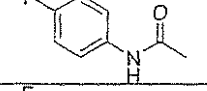
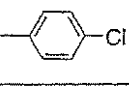
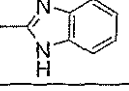
30

40

【 0 2 6 6 】

50

【表 2 1 6】

E657			
E658			
E659			
E660			
E661			
E662			
E663			
E664			
E665			
E666			
E667			
E668			
E669			
E670			
E671			
E672			
E673			

10

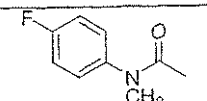
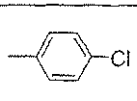
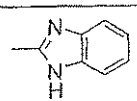
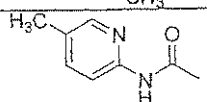
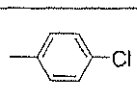
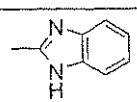
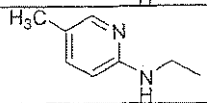
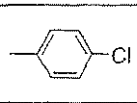
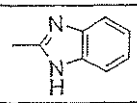
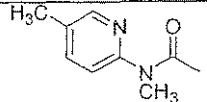
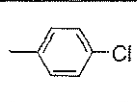
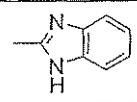
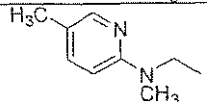
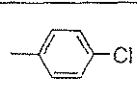
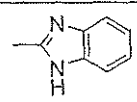
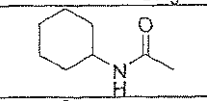
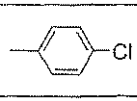
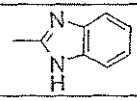
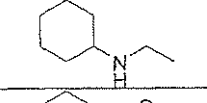
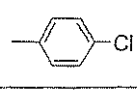
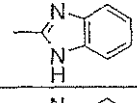
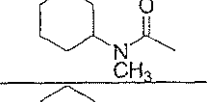
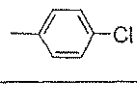
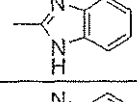
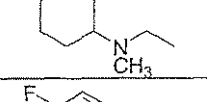
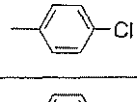
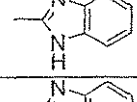
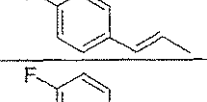
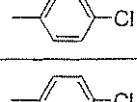
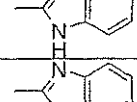
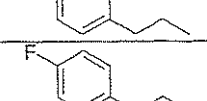
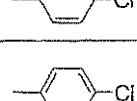
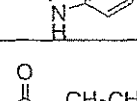
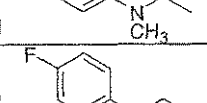
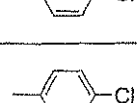
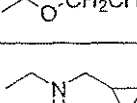
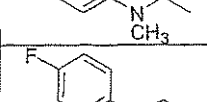
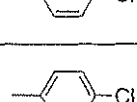
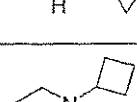
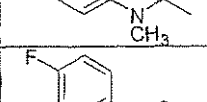
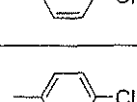
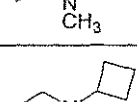
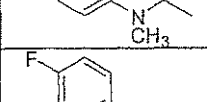
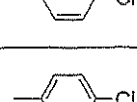
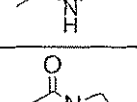
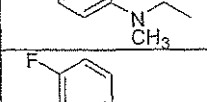
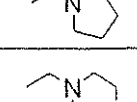
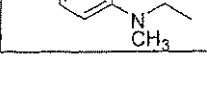
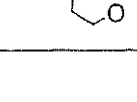
20

30

40

【0 2 6 7】

【表 2 1 7】

E674			
E675			
E676			
E677			
E678			
E679			
E680			
E681			
E682			
E683			
E684			
E685			
E686			
E687			
E688			
E689			
E690			

【0 2 6 8】

10

20

30

40

【表 2 1 8】

E691			
E692			
E693			
E694			
E695			
E696			
E697			
E698			
E699			
E700			
E701			
E702			
E703			
E704			
E705			

10

20

30

40

【0 2 6 9】

【表 2 1 9】

E706			
E707			
E708			
E709			
E710			
E711			
E712			
E713			
E714			
E715			
E716			
E717			
E718			
E719			
E720			

10

20

30

40

【0 2 7 0】

【表 2 2 0】

E721			
E722			
E723			
E724			
E725			
E726			
E727			
E728			
E729			
E730			
E731			
E732			
E733			
E734			
E735			
E736			

10

20

30

40

【0 2 7 1】

【表 2 2 1】

E737			
E738			
E739			
E740			
E741			
E742			
E743			
E744			
E745			
E746			
E747			
E748			
E749			
E750		CH_3	
E751			
E752			
E753			

10

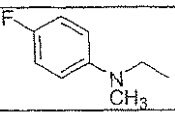
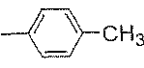
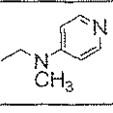
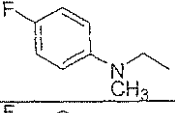
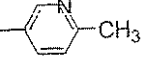
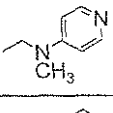
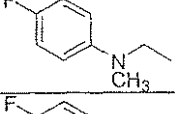
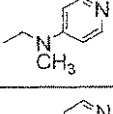
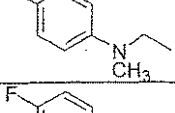
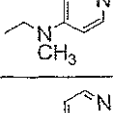
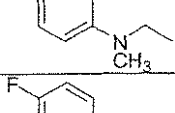
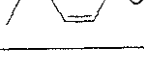
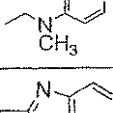
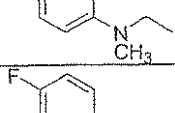
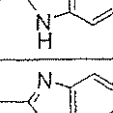
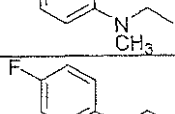
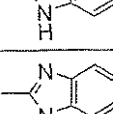
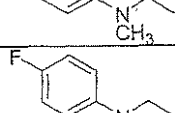
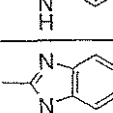
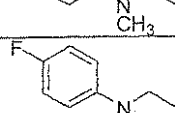
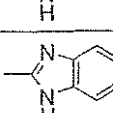
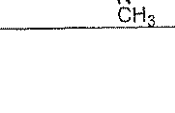
20

30

40

【0 2 7 2】

【表 2 2 2】

E754			
E755			
E756		CH ₃	
E757			
E758			
E759			
E760			
E761		CH ₃	
E762			
E763			

10

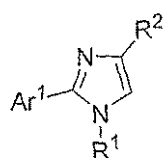
20

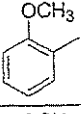
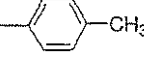
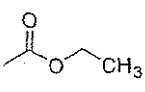
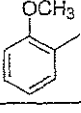
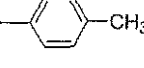
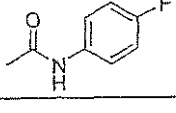
【0 2 7 3】

30

【表 2 2 3】

表 F-1

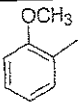
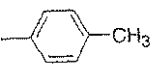
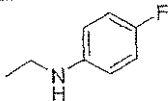
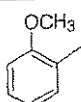
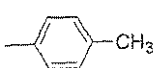
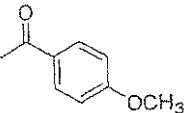
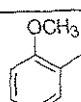
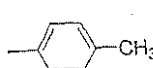
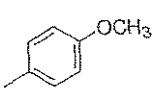
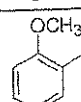
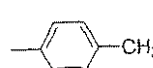
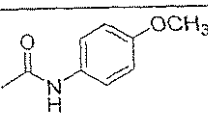
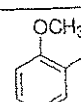
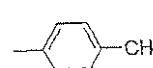
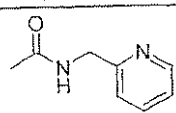
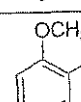
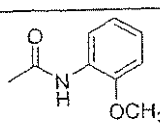
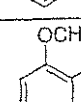
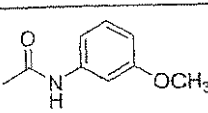
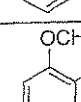
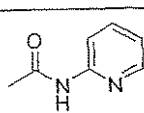
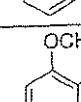
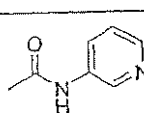
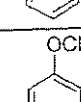
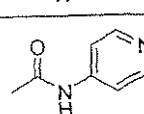
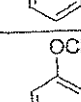
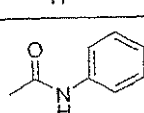
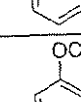
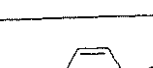
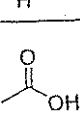
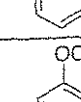
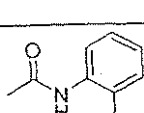
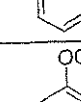
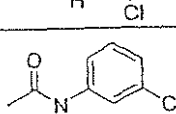


Cpd No.	Ar ¹	R ¹	R ²
F1			
F2			

40

【0 2 7 4】

【表 2 2 4】

F3			
F4			
F5			
F6			
F7			
F8			
F9			
F10			
F11			
F12			
F13			
F14			
F15			
F16			

10

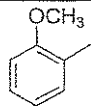
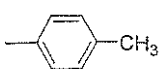
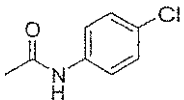
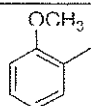
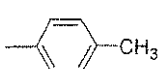
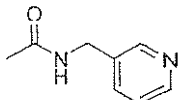
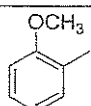
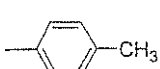
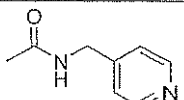
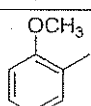
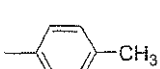
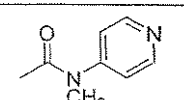
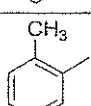
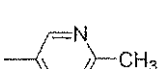
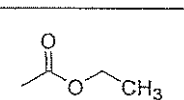
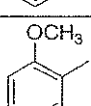
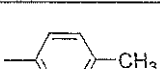
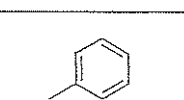
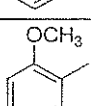
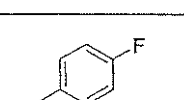
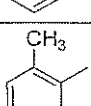
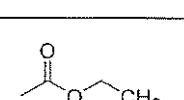
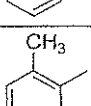
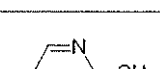
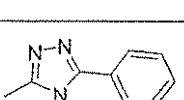
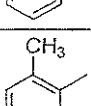
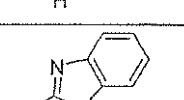
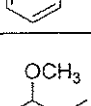
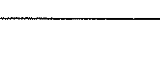
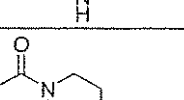
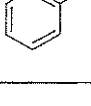
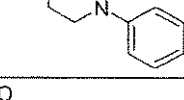
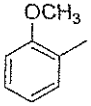
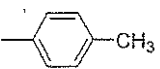
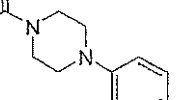
20

30

40

【0 2 7 5】

【表 2 2 5】

F17			
F18			
F19			
F20			
F21			
F22			
F23			
F24			
F25			
F26			
F27			
F28			
F29			

10

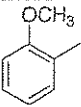
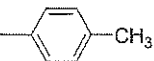
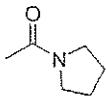
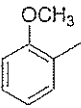
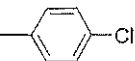
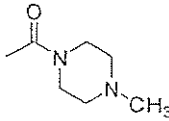
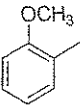
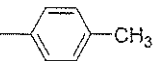
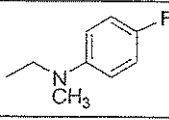
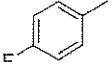
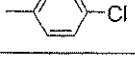
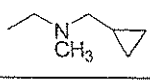
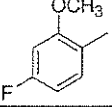
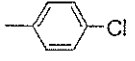
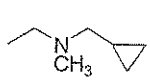
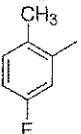
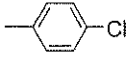
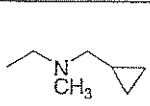
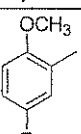
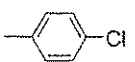
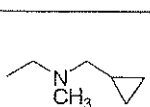
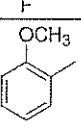
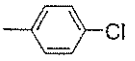
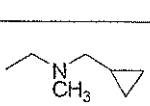
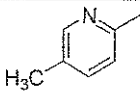
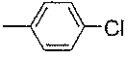
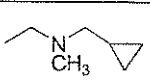
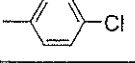
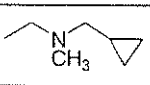
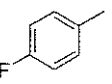
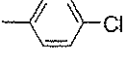
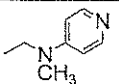
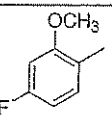
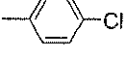
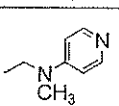
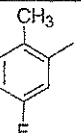
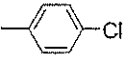
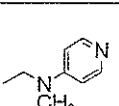
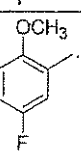
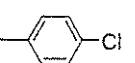
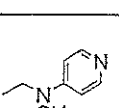
20

30

40

【0 2 7 6】

【表 2 2 6】

F30			
F31			
F32			
F33			
F34			
F35			
F36			
F37			
F38			
F39			
F40			
F41			
F42			
F43			

10

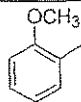
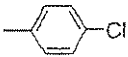
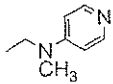
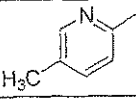
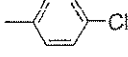
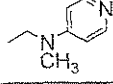
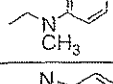
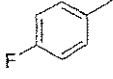
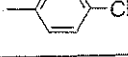
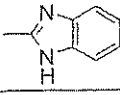
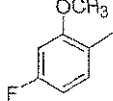
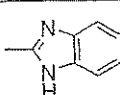
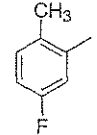
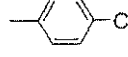
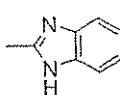
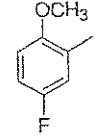
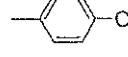
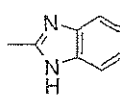
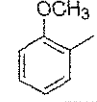
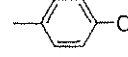
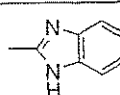
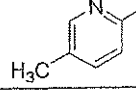
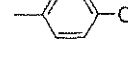
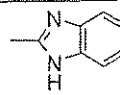
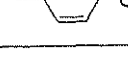
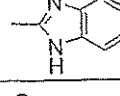
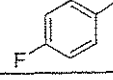
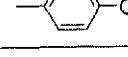
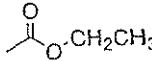
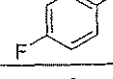
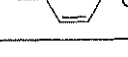
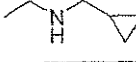
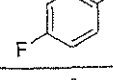
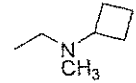
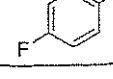
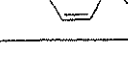
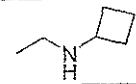
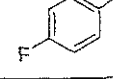
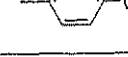
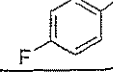
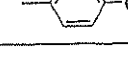
20

30

40

【0 2 7 7】

【表 2 2 7】

F44			
F45			
F46			
F47			
F48			
F49			
F50			
F51			
F52			
F53			
F54			
F55			
F56			
F57			
F58			
F59			

10

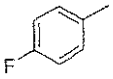
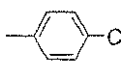
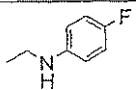
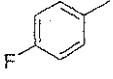
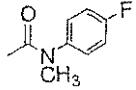
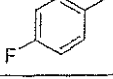
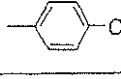
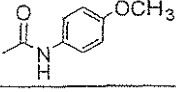
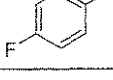
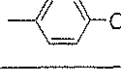
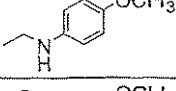
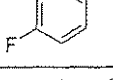
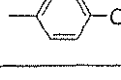
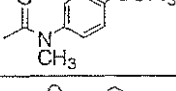
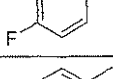
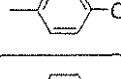
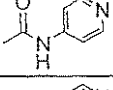
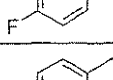
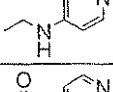
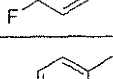
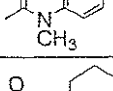
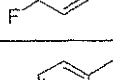
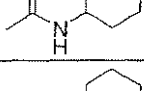
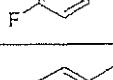
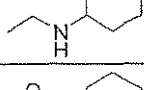
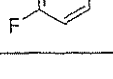
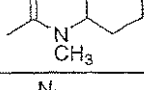
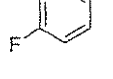
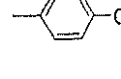
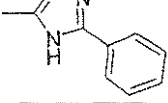
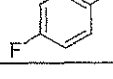
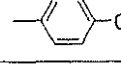
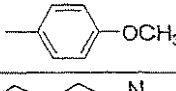
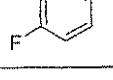
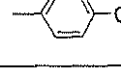
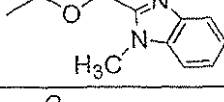
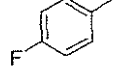
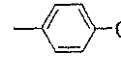
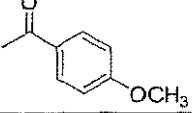
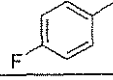
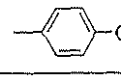
20

30

40

【0 2 7 8】

【表 2 2 8】

F60			
F61			
F62			
F63			
F64			
F65			
F66			
F67			
F68			
F69			
F70			
F71			
F72			
F73			
F74			
F75			

10

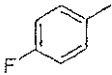
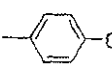
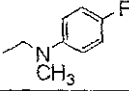
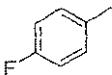
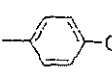
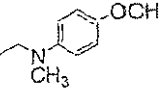
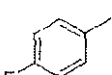
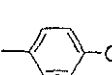
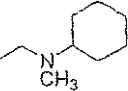
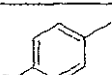
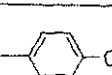
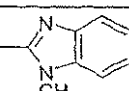
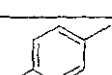
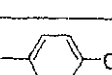
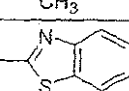
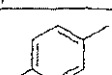
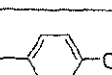
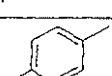
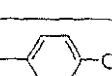
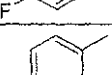
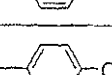
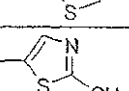
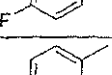
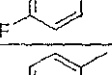
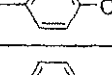
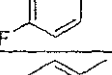
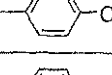
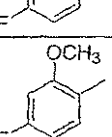
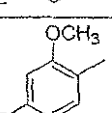
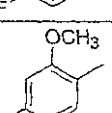
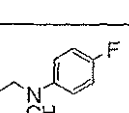
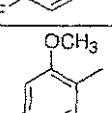
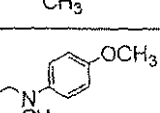
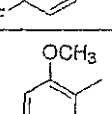
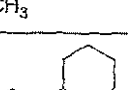
20

30

40

【0 2 7 9】

【表 2 2 9】

F76			
F77			
F78			
F79			
F80			
F81			
F82			
F83			
F84			
F85			
F86			
F87			
F88			
F89			
F90			
F91			

10

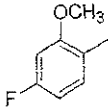
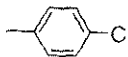
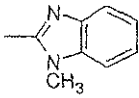
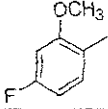
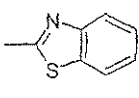
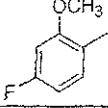
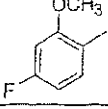
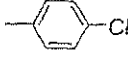
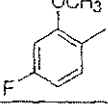
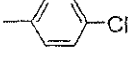
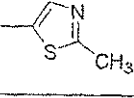
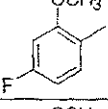
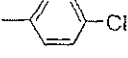
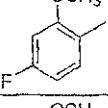
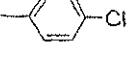
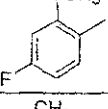
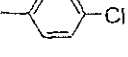
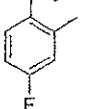
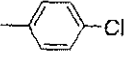
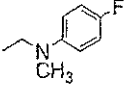
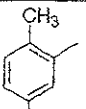
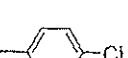
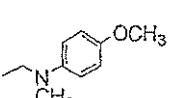
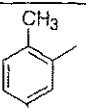
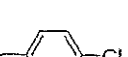
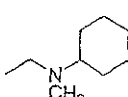
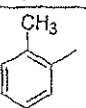
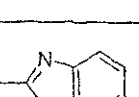
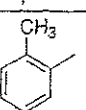
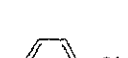
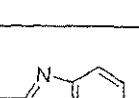
20

30

40

【0 2 8 0】

【表 2 3 0】

F92			
F93			
F94			
F95			
F96			
F97			
F98			
F99			
F100			
F101			
F102			
F103			
F104			

10

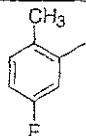
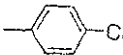
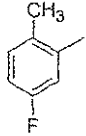
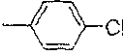
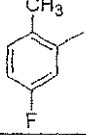
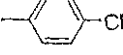
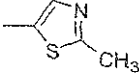
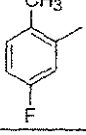
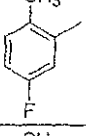
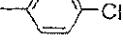
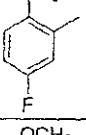
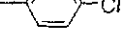
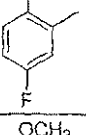
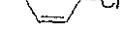
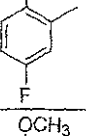
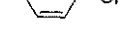
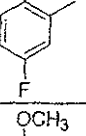
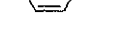
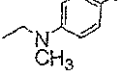
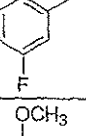
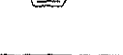
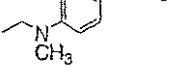
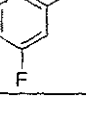
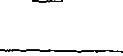
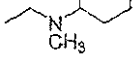
20

30

40

【0 2 8 1】

【表 2 3 1】

F105			
F106			
F107			
F108			
F109			
F110			
F111			
F112			
F113			
F114			
F115			

10

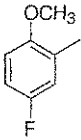
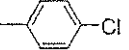
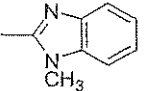
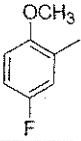
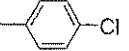
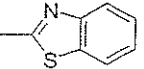
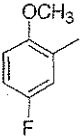
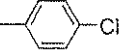
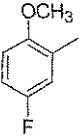
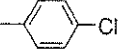
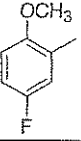
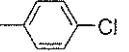
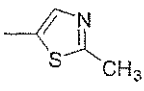
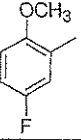
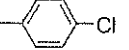
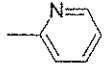
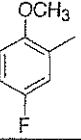
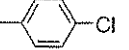
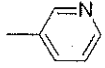
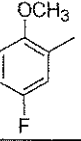
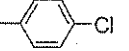
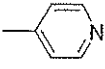
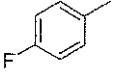
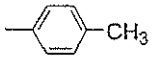
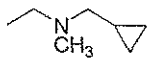
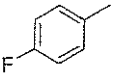
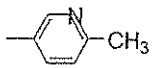
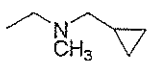
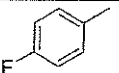
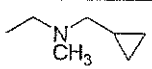
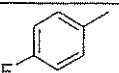
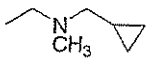
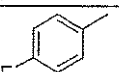
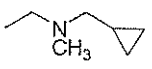
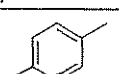
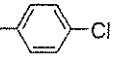
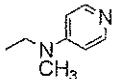
20

30

40

【0 2 8 2】

【表 2 3 2】

F116			
F117			
F118			
F119			
F120			
F121			
F122			
F123			
F124			
F125			
F126			
F127			
F128			
F129			

【0 2 8 3】

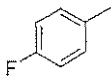
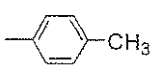
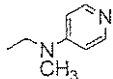
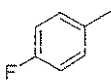
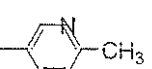
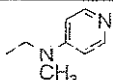
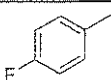
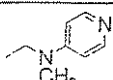
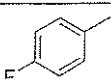
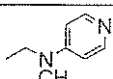
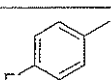
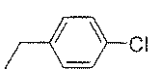
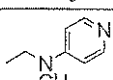
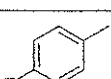
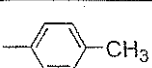
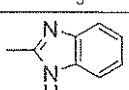
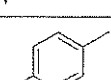
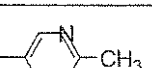
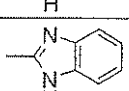
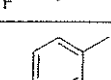
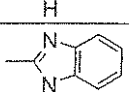
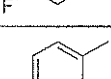
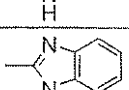
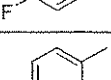
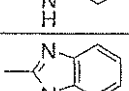
10

20

30

40

【表 2 3 3】

F130			
F131			
F132		CH ₃	
F133			
F134			
F135			
F136			
F137		CH ₃	
F139			
F140			

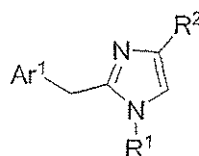
10

20

【0 2 8 4】

【表 2 3 4】

表 G-1A



Cpd No.	Ar ¹	R ¹	R ²
G-1			
G-2			
G-3			
G-4			
G-5			
G-6			
G-7			
G-8			
G-9			
G-10			

10

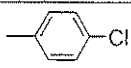
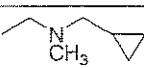
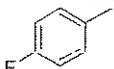
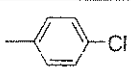
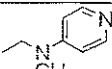
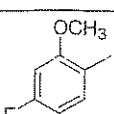
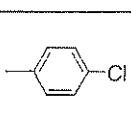
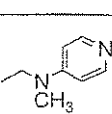
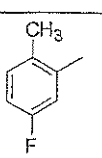
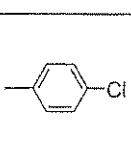
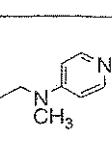
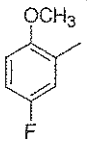
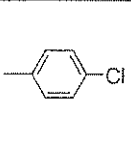
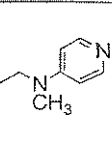
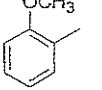
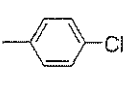
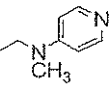
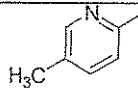
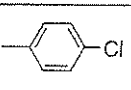
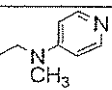
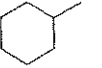
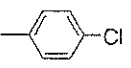
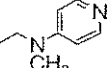
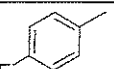
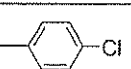
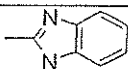
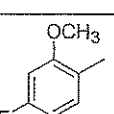
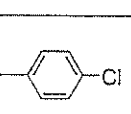
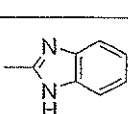
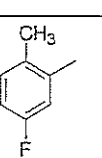
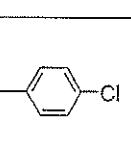
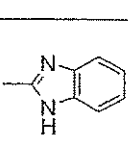
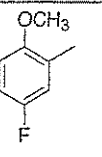
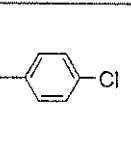
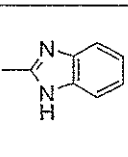
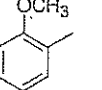
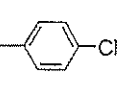
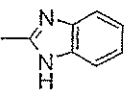
20

30

40

【0 2 8 5】

【表 2 3 5】

G-11			
G-12			
G-13			
G-14			
G-15			
G-16			
G-17			
G-18			
G-19			
G-20			
G-21			
G-22			
G-23			

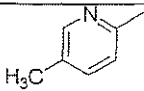
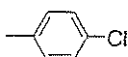
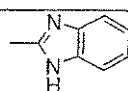
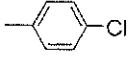
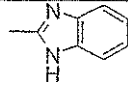
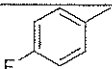
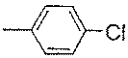
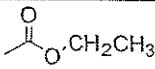
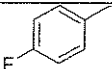
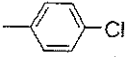
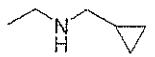
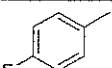
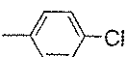
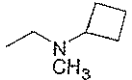
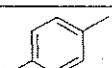
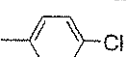
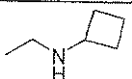
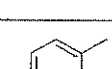
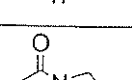
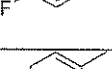
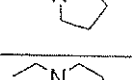
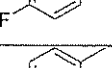
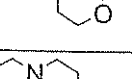
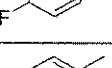
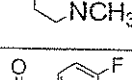
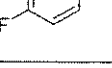
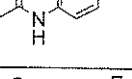
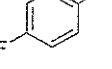
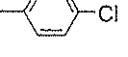
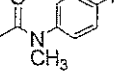
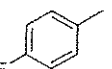
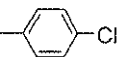
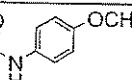
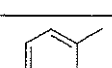
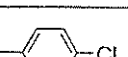
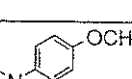
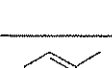
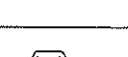
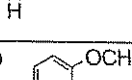
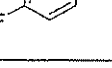
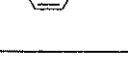
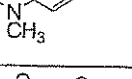
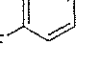
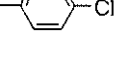
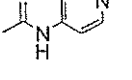
10

20

30

40

【表 2 3 6】

G-24			
G-25			
G-26			
G-27			
G-28			
G-29			
G-30			
G-31			
G-32			
G-33			
G-34			
G-35			
G-36			
G-37			
G-38			
G-39			
G-40			

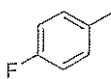
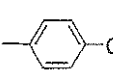
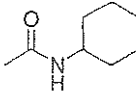
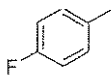
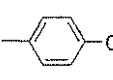
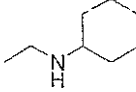
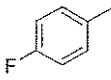
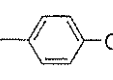
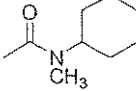
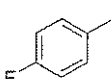
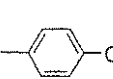
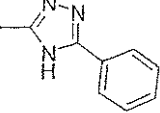
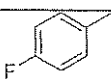
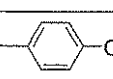
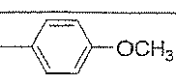
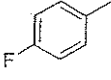
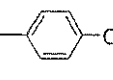
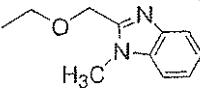
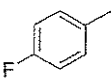
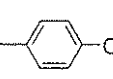
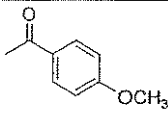
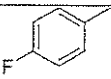
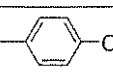
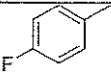
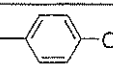
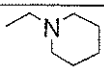
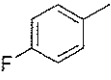
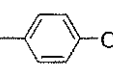
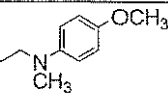
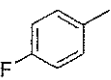
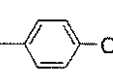
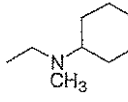
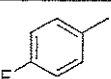
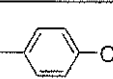
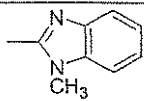
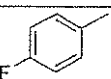
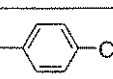
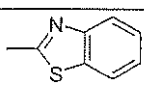
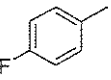
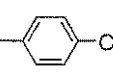
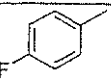
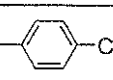
10

20

30

40

【表 2 3 7】

G-41			
G-42			
G-43			
G-44			
G-45			
G-46			
G-47			
G-48			
G-49			
G-50			
G-51			
G-52			
G-53			
G-54			
G-55			

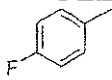
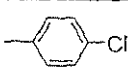
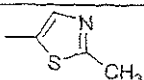
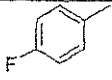
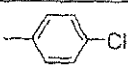
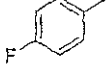
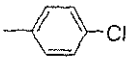
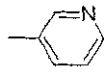
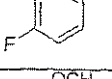
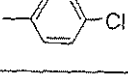
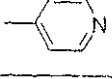
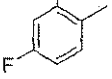
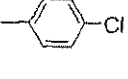
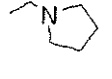
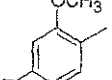
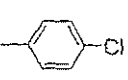
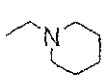
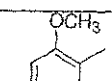
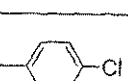
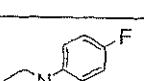
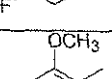
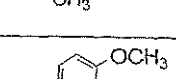
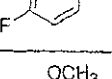
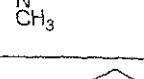
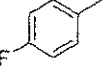
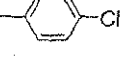
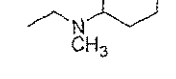
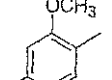
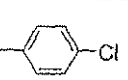
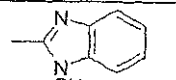
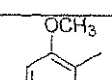
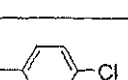
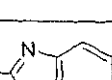
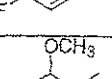
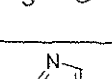
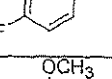
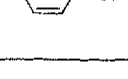
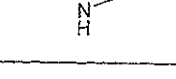
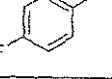
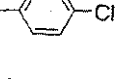
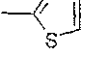
10

20

30

40

【表 2 3 8】

G-56			
G-57			
G-58			
G-59			
G-60			
G-61			
G-62			
G-63			
G-64			
G-65			
G-66			
G-67			
G-68			
G-69			
G-70			

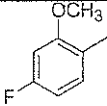
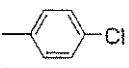
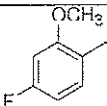
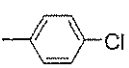
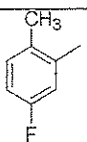
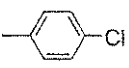
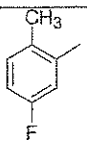
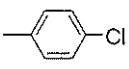
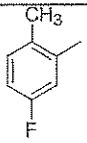
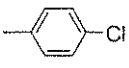
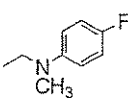
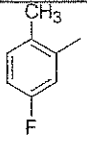
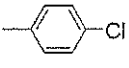
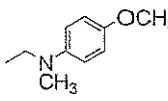
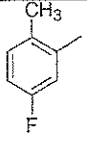
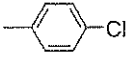
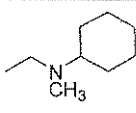
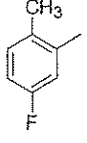
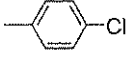
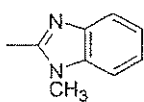
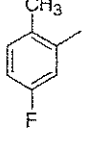
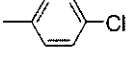
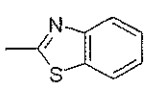
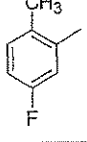
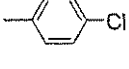
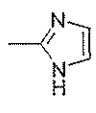
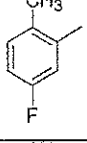
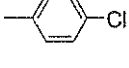
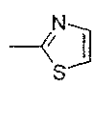
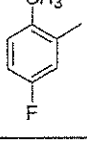
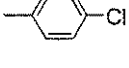
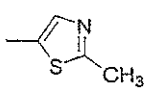
10

20

30

40

【表 2 3 9】

G-71			
G-72			
G-73			
G-74			
G-75			
G-76			
G-77			
G-78			
G-79			
G-80			
G-81			
G-82			

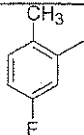
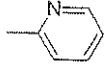
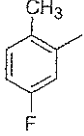
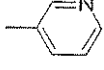
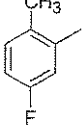
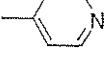
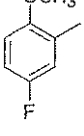
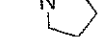
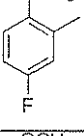
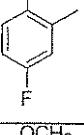
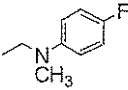
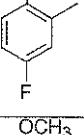
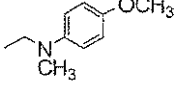
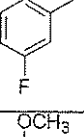
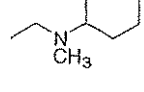
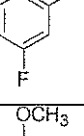
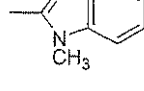
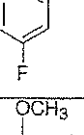
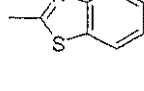
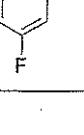
10

20

30

40

【表 2 4 0】

G-83			
G-84			
G-85			
G-86			
G-87			
G-88			
G-89			
G-90			
G-91			
G-92			
G-93			

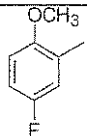
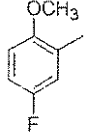
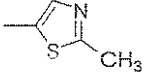
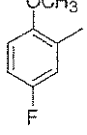
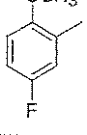
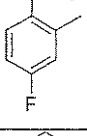
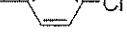
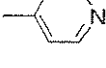
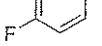
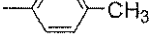
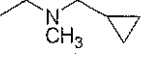
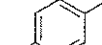
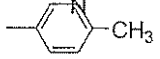
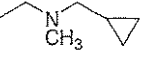
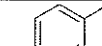
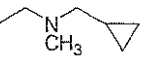
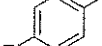
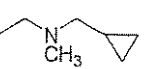
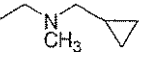
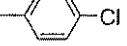
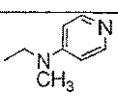
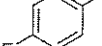
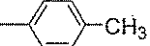
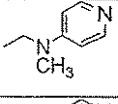
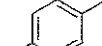
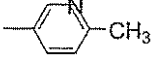
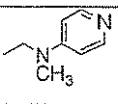
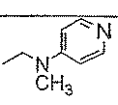
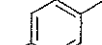
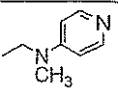
10

20

30

40

【表 2 4 1】

G-94			
G-95			
G-96			
G-97			
G-98			
G-99			
G-100			
G-101			
G-102			
G-103			
G-104			
G-105			
G-106			
G-107			
G-108			

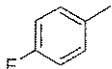
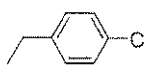
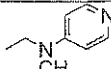
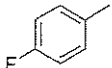
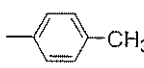
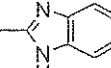
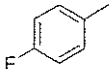
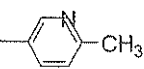
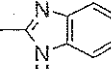
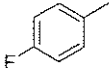
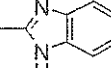
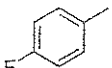
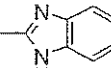
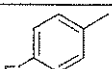
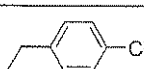
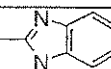
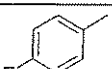
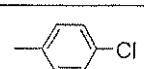
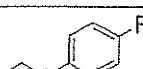
10

20

30

40

【表 2 4 2】

G-109			
G-110			
G-111			
G-112		CH ₃	
G-113			
G-114			
G-115			

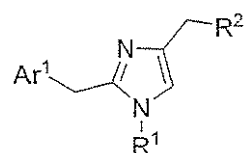
10

20

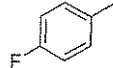
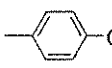
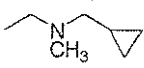
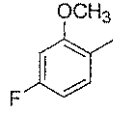
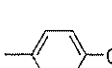
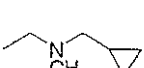
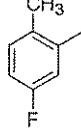
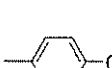
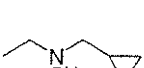
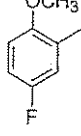
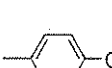
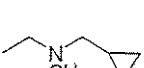
【 0 2 9 3 】

【表 2 4 3】

表 G-1B



30

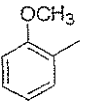
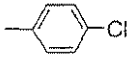
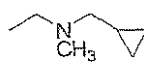
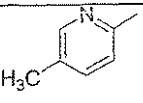
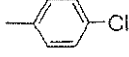
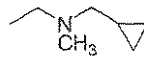
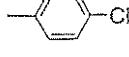
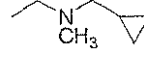
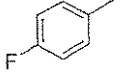
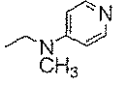
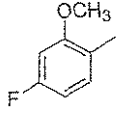
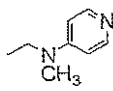
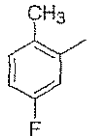
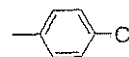
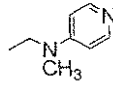
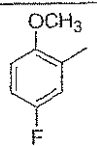
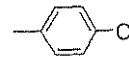
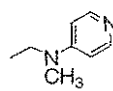
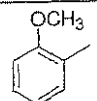
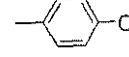
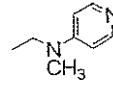
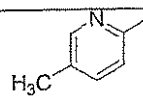
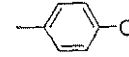
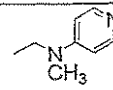
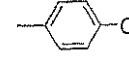
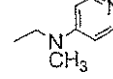
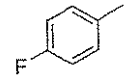
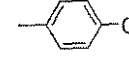
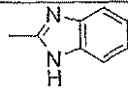
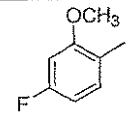
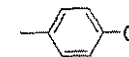
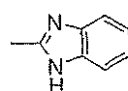
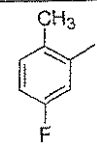
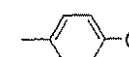
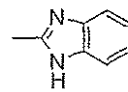
Cpd No.	Ar ¹	R ¹	R ²
G-116			
G-117			
G-118			
G-119			

40

【 0 2 9 4 】

50

【表 2 4 4】

G-120			
G-121			
G-122			
G-123			
G-124			
G-125			
G-126			
G-127			
G-128			
G-129			
G-130			
G-131			
G-132			

10

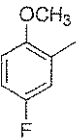
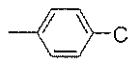
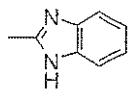
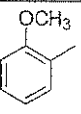
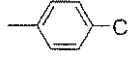
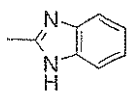
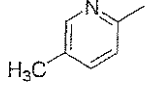
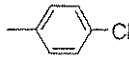
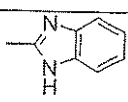
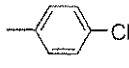
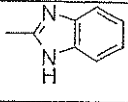
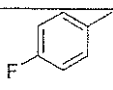
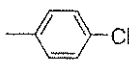
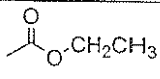
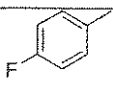
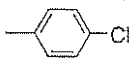
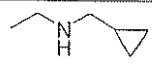
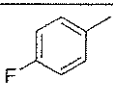
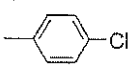
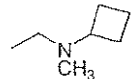
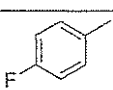
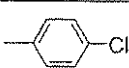
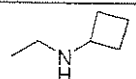
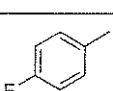
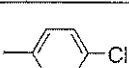
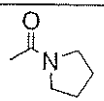
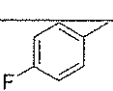
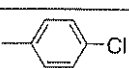
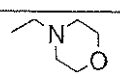
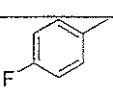
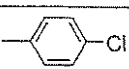
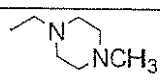
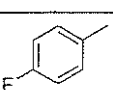
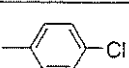
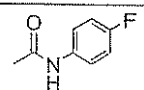
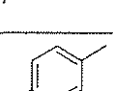
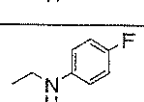
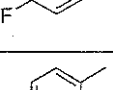
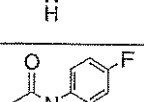
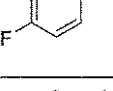
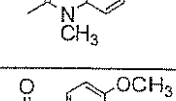
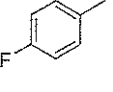
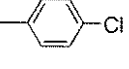
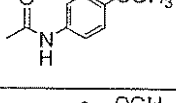
20

30

40

【0 2 9 5】

【表 2 4 5】

G-133			
G-134			
G-135			
G-136			
G-137			
G-138			
G-139			
G-140			
G-141			
G-142			
G-143			
G-144			
G-145			
G-146			
G-147			
G-148			

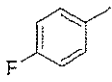
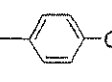
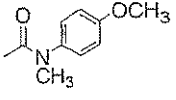
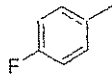
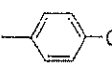
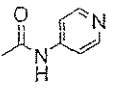
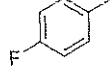
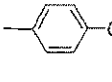
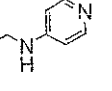
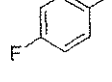
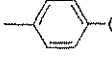
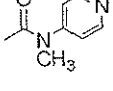
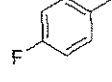
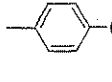
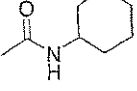
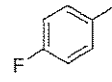
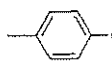
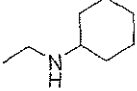
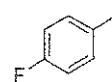
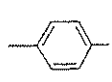
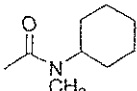
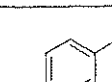
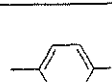
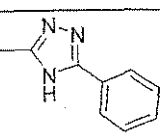
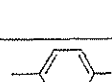
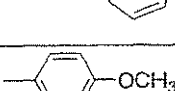
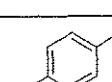
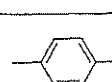
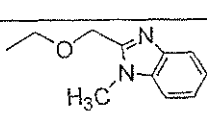
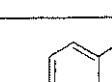
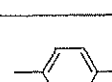
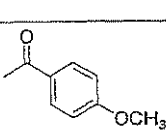
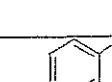
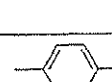
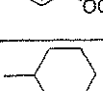
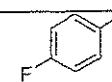
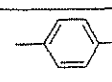
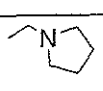
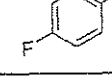
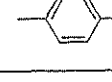
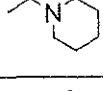
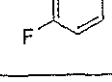
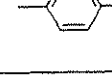
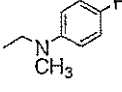
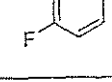
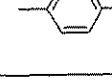
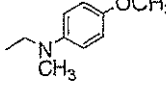
10

20

30

40

【表 2 4 6】

G-149			
G-150			
G-151			
G-152			
G-153			
G-154			
G-155			
G-156			
G-157			
G-158			
G-159			
G-160			
G-161			
G-162			
G-163			
G-164			

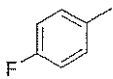
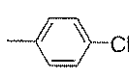
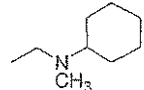
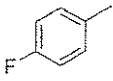
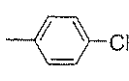
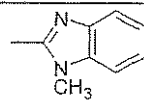
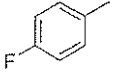
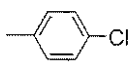
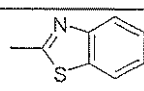
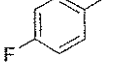
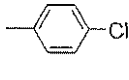
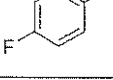
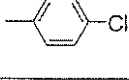
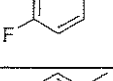
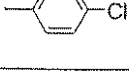
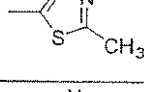
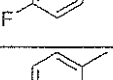
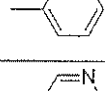
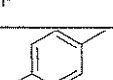
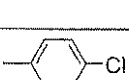
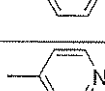
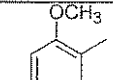
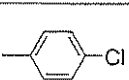
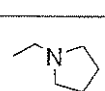
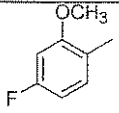
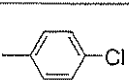
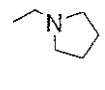
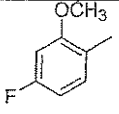
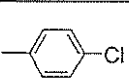
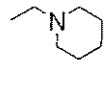
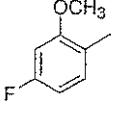
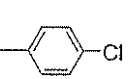
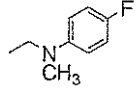
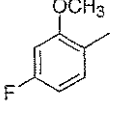
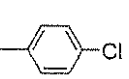
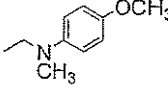
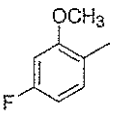
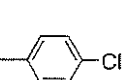
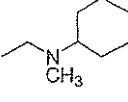
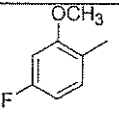
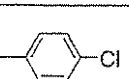
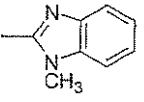
10

20

30

40

【表 2 4 7】

G-165			
G-166			
G-167			
G-168			
G-169			
G-170			
G-171			
G-172			
G-173			
G-174			
G-175			
G-176			
G-177			
G-178			
G-179			

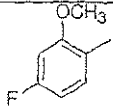
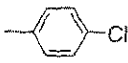
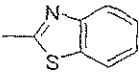
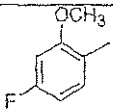
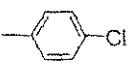
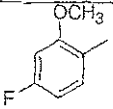
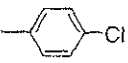
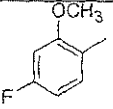
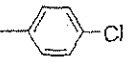
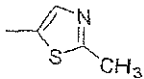
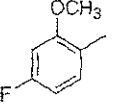
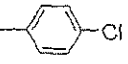
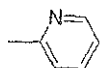
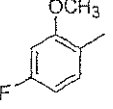
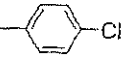
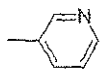
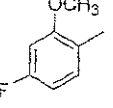
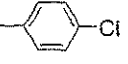
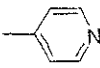
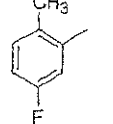
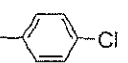
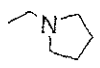
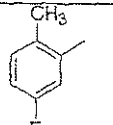
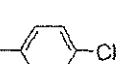
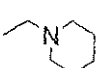
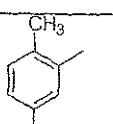
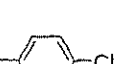
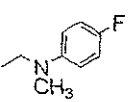
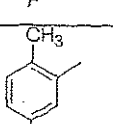
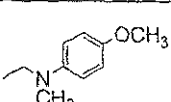
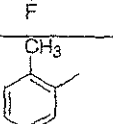
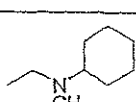
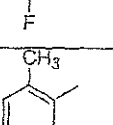
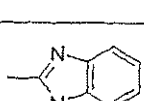
10

20

30

40

【表 2 4 8】

G-180			
G-181			
G-182			
G-183			
G-184			
G-185			
G-186			
G-187			
G-188			
G-189			
G-190			
G-191			
G-192			

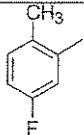
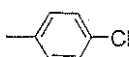
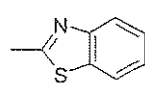
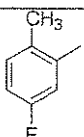
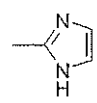
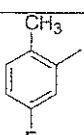
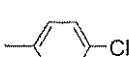
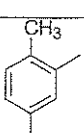
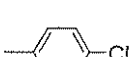
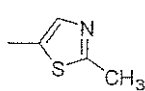
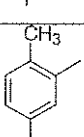
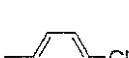
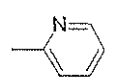
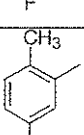
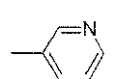
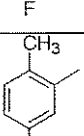
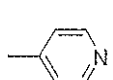
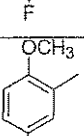
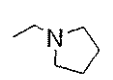
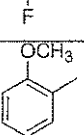
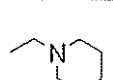
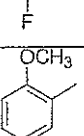
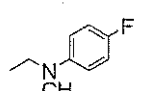
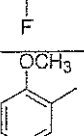
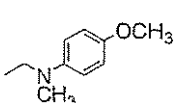
10

20

30

40

【表 2 4 9】

G-193			
G-194			
G-195			
G-196			
G-197			
G-198			
G-199			
G-200			
G-201			
G-202			
G-203			

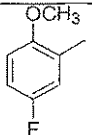
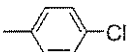
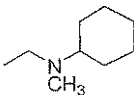
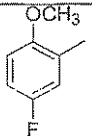
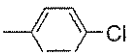
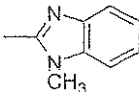
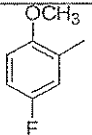
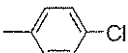
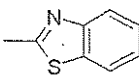
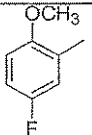
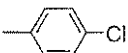
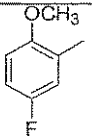
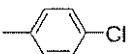
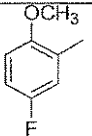
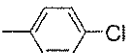
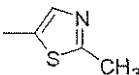
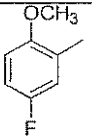
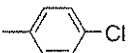
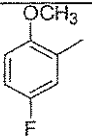
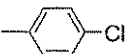
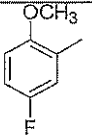
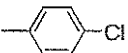
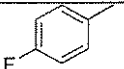
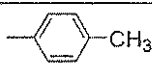
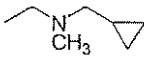
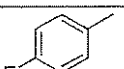
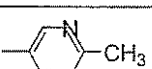
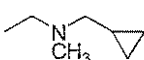
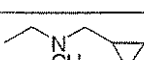
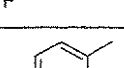
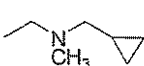
10

20

30

40

【表 2 5 0】

G-204			
G-205			
G-206			
G-207			
G-208			
G-209			
G-210			
G-211			
G-212			
G-213			
G-214			
G-215			
G-216			

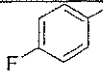
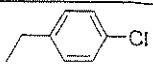
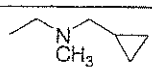
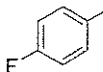
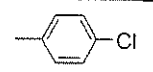
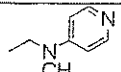
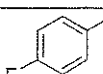
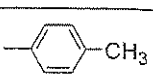
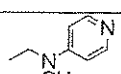
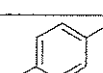
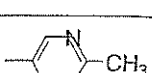
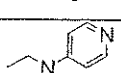
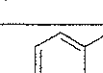
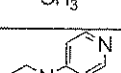
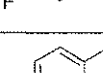
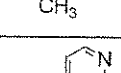
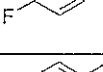
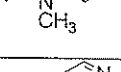
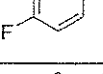
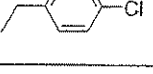
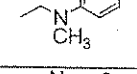
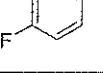
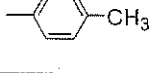
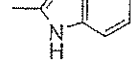
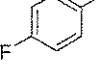
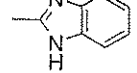
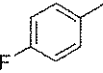
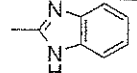
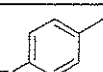
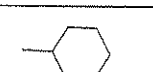
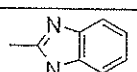
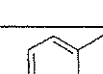
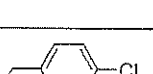
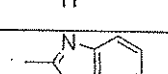
10

20

30

40

【表 2 5 1】

G-217			
G-218			
G-219			
G-220			
G-221		CH ₃	
G-222			
G-223			
G-224			
G-225			
G-226		CH ₃	
G-227			
G-228			
G229			

10

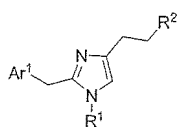
20

30

【0 3 0 2】

【表 2 5 2】

表 G-1C



Cpd No.	Ar¹	R¹	R²
G-230			
G-231			
G-232			
G-233			
G-234			
G-235			
G-236			
G-237			
G-238			
G-239			
G-240			
G-241			
G-242			

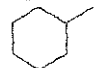
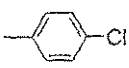
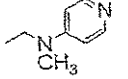
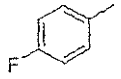
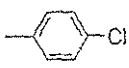
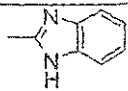
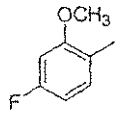
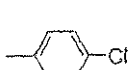
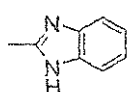
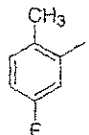
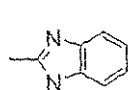
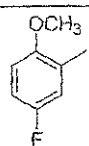
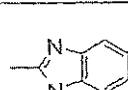
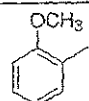
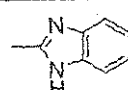
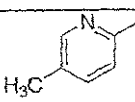
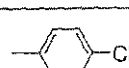
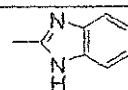
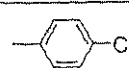
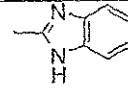
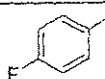
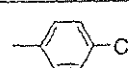
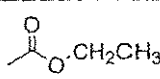
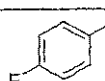
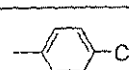
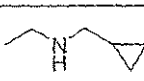
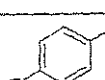
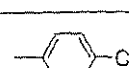
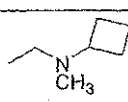
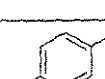
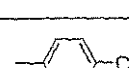
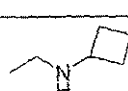
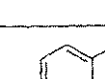
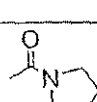
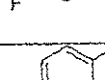
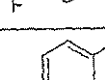
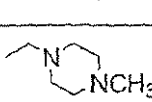
10

20

30

【0 3 0 3】

【表 2 5 3】

G-243			
G-244			
G-245			
G-246			
G-247			
G-248			
G-249			
G-250			
G-251			
G-252			
G-253			
G-254			
G-255			
G-256			
G-257			

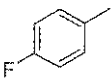
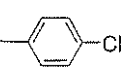
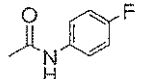
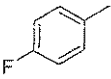
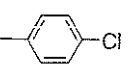
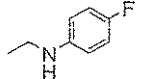
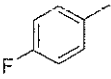
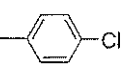
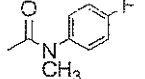
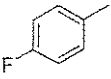
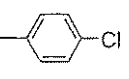
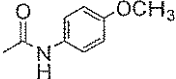
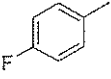
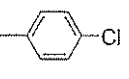
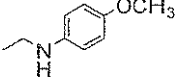
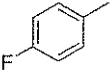
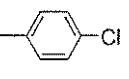
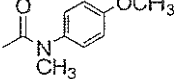
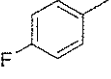
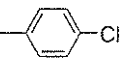
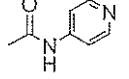
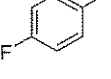
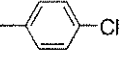
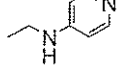
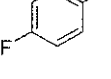
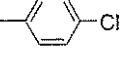
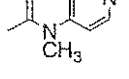
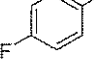
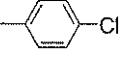
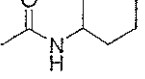
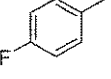
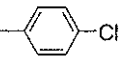
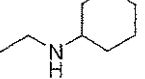
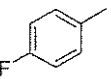
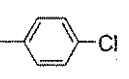
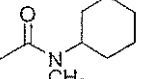
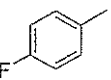
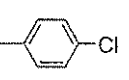
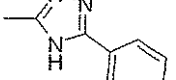
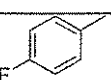
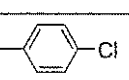
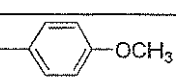
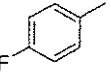
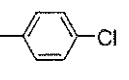
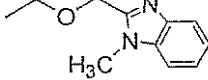
10

20

30

40

【表 2 5 4】

G-258			
G-259			
G-260			
G-261			
G-262			
G-263			
G-264			
G-265			
G-266			
G-267			
G-268			
G-269			
G-270			
G-271			
G-272			

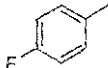
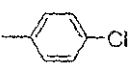
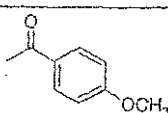
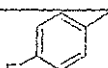
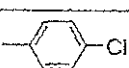
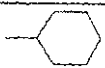
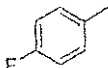
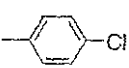
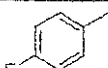
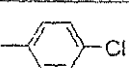
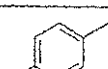
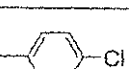
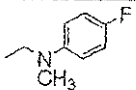
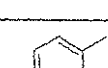
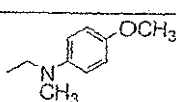
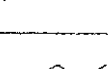
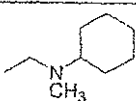
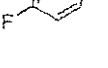
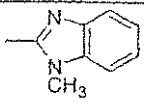
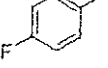
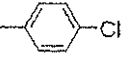
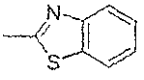
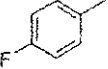
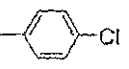
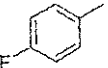
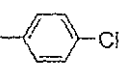
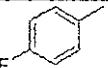
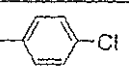
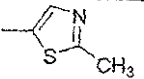
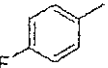
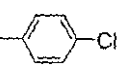
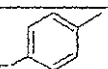
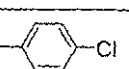
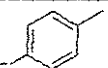
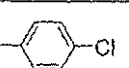
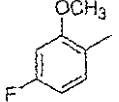
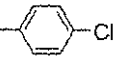
10

20

30

40

【表 2 5 5】

G-273			
G-274			
G-275			
G-276			
G-277			
G-278			
G-279			
G-280			
G-281			
G-282			
G-283			
G-284			
G-285			
G-286			
G-287			
G-288			

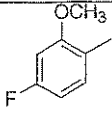
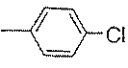
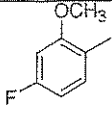
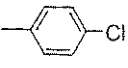
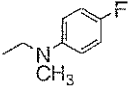
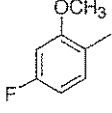
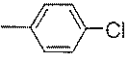
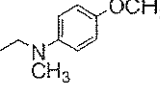
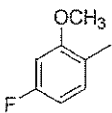
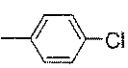
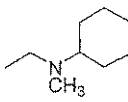
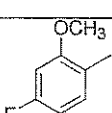
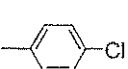
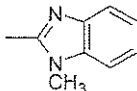
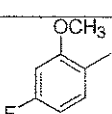
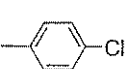
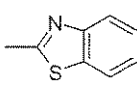
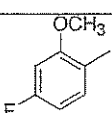
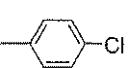
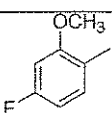
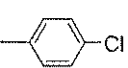
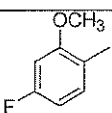
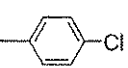
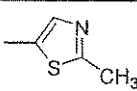
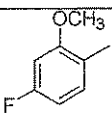
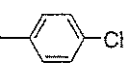
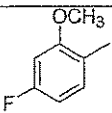
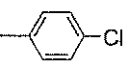
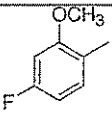
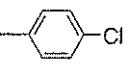
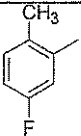
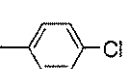
10

20

30

40

【表 2 5 6】

G-289			
G-290			
G-291			
G-292			
G-293			
G-294			
G-295			
G-296			
G-297			
G-298			
G-299			
G-300			
G-301			

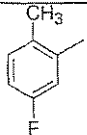
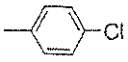
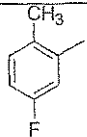
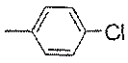
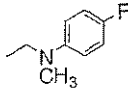
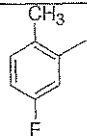
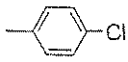
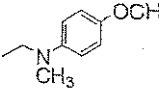
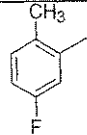
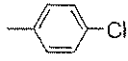
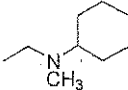
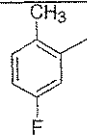
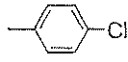
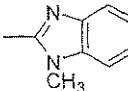
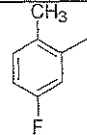
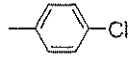
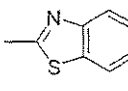
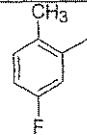
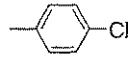
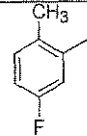
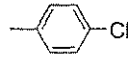
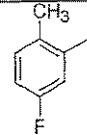
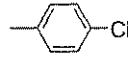
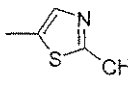
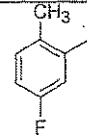
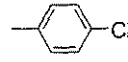
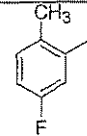
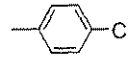
10

20

30

40

【表 2 5 7】

G-302			
G-303			
G-304			
G-305			
G-306			
G-307			
G-308			
G-309			
G-310			
G-311			
G-312			

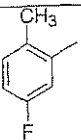
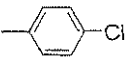
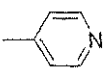
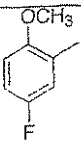
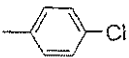
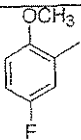
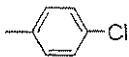
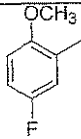
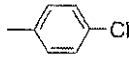
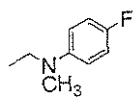
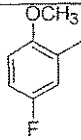
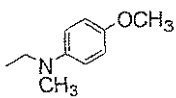
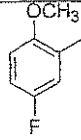
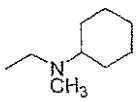
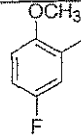
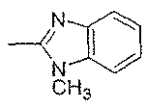
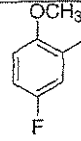
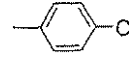
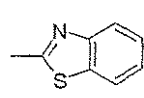
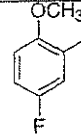
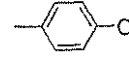
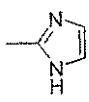
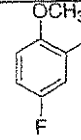
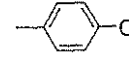
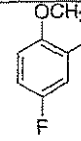
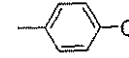
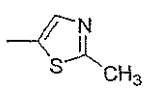
10

20

30

40

【表 2 5 8】

G-313			
G-314			
G-315			
G-316			
G-317			
G-318			
G-319			
G-320			
G-321			
G-322			
G-323			

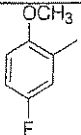
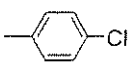
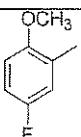
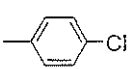
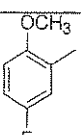
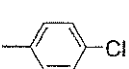
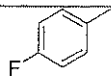
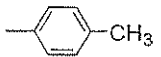
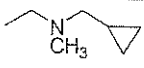
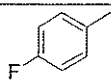
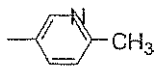
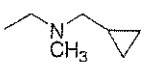
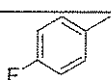
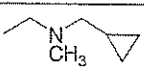
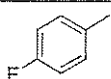
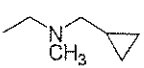
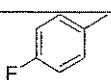
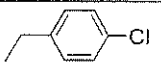
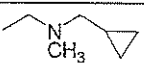
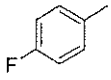
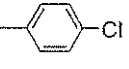
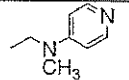
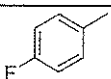
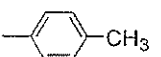
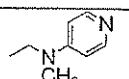
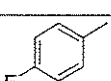
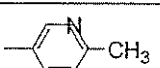
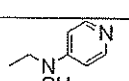
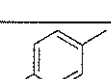
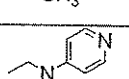
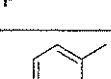
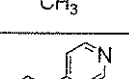
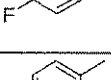
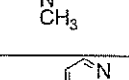
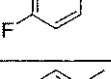
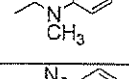
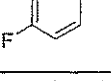
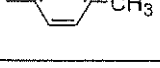
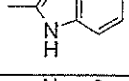
10

20

30

40

【表 2 5 9】

G-324			
G-325			
G-326			
G-327			
G-328			
G-329		CH_3	
G-330			
G-331			
G-332			
G-333			
G-334			
G-335		CH_3	
G-336			
G-337			
G-338			
G-339			

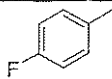
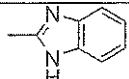
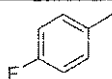
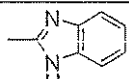
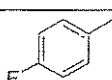
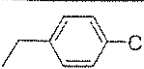
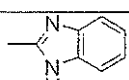
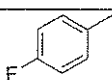
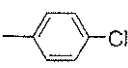
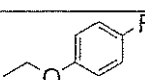
10

20

30

40

【表 2 6 0】

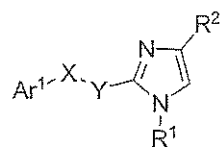
G-340		CH ₃	
G-341			
G-342			
G343			

10

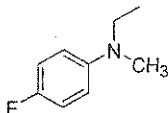
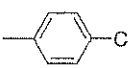
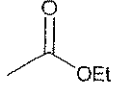
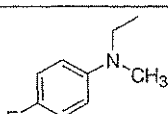
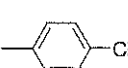
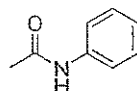
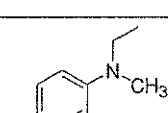
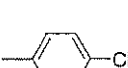
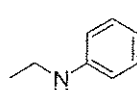
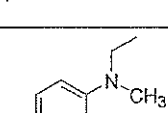
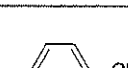
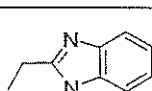
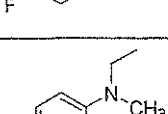
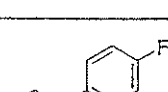
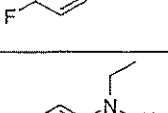
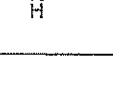
【 0 3 1 1 】

【表 2 6 1】

表 H-1A



20

Cpd. No.	Ar ¹ -X-Y	R ¹	R ²
H-1			
H-2			
H-3			
H-4			
H-5			
H-6			

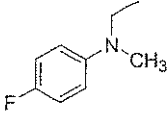
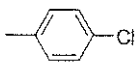
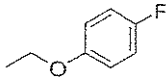
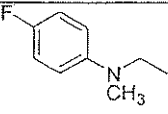
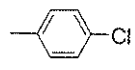
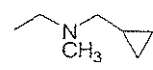
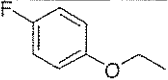
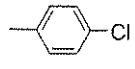
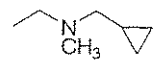
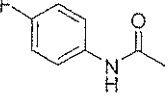
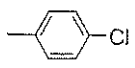
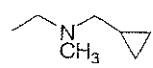
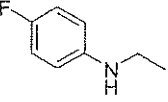
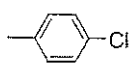
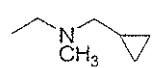
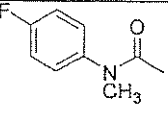
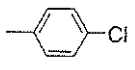
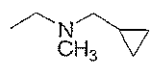
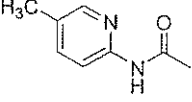
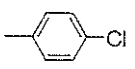
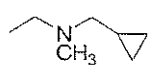
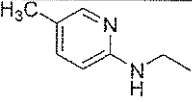
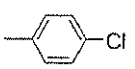
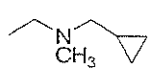
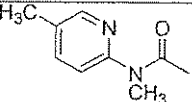
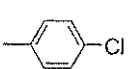
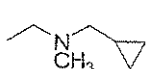
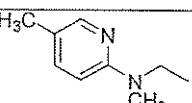
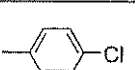
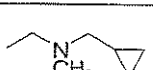
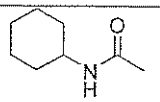
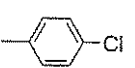
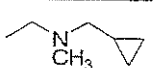
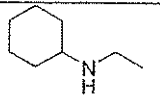
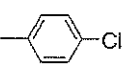
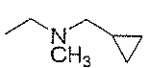
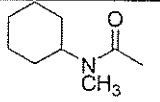
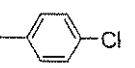
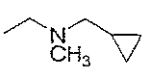
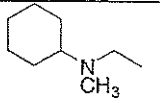
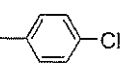
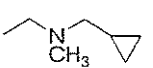
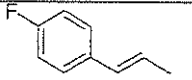
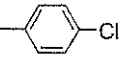
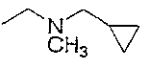
30

40

50

【 0 3 1 2 】

【 表 2 6 2 】

H-7			
H-8			
H-9			
H-10			
H-11			
H-12			
H-13			
H-14			
H-15			
H-16			
H-17			
H-18			
H-19			
H-20			
H-21			

10

20

30

40

【 0 3 1 3 】

50

【表 2 6 3】

H-22			
H-23			
H-24			
H-25			
H-26			
H-27			
H-28			
H-29			
H-30			
H-31			
H-32			
H-33			
H-34			
H-35			
H-36			
H-37			

10

20

30

40

【表 2 6 4】

H-38			
H-39			
H-40			
H-41			
H-42			
H-43			
H-44			
H-45			
H-46			
H-47			
H-48			
H-49			
H-50			
H-51			
H-52			

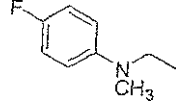
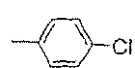
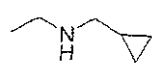
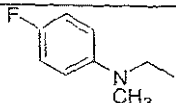
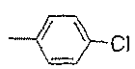
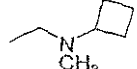
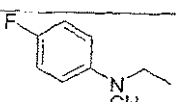
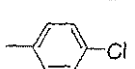
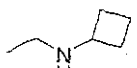
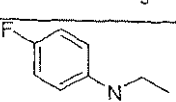
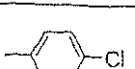
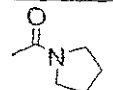
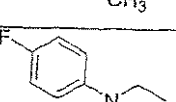
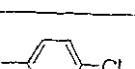
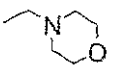
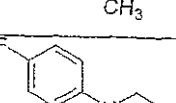
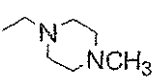
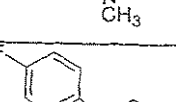
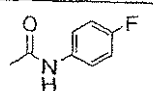
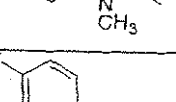
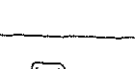
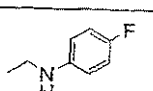
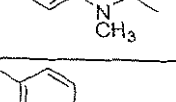
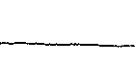
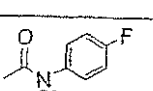
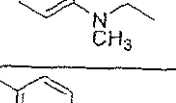
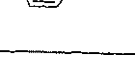
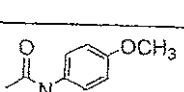
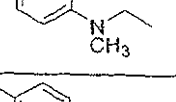
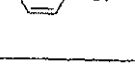
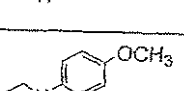
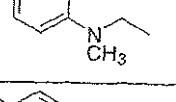
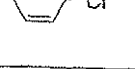
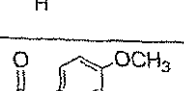
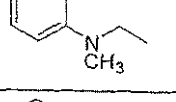
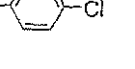
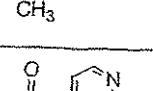
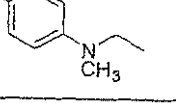
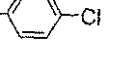
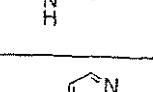
10

20

30

40

【表 2 6 5】

H-53			
H-54			
H-55			
H-56			
H-57			
H-58			
H-59			
H-60			
H-61			
H-62			
H-63			
H-64			
H-65			
H-66			

10

20

30

40

【表 2 6 6】

H-67			
H-68			
H-69			
H-70			
H-71			
H-72			
H-73			
H-74			
H-75			
H-76			
H-77			
H-78			
H-79			
H-80			

10

20

30

40

【表 2 6 7】

H-81			
H-82			
H-83			
H-84			
H-85			
H-86			
H-87			
H-88			
H-89			
H-90			
H-91			
H-92			
H-93			
H-94			

10

20

30

40

【表 2 6 8】

H-95			
H-96			
H-97			
H-98			
H-99			
H-100			
H-101			
H-102			
H-103			
H-104			
H-105			
H-106			
H-107			
H-108			
H-109			

10

20

30

40

【表 2 6 9】

H-110			
H-111			
H-112			
H-113			
H-114			
H-115			
H-116		CH ₃	
H-117			
H-118			
H-119			
H-120			
H-121			
H-122		CH ₃	
H-123			
H-124			

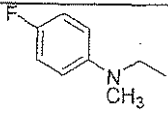
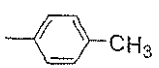
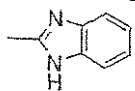
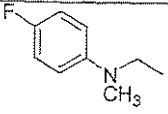
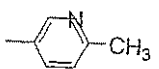
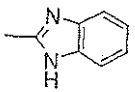
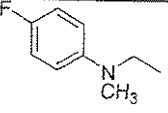
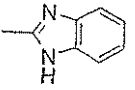
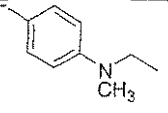
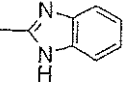
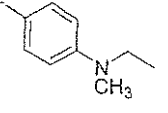
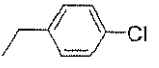
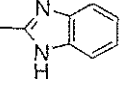
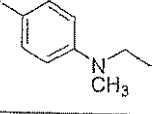
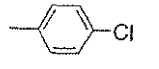
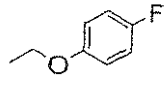
10

20

30

40

【表 2 7 0】

H-125			
H-126			
H-127		CH_3	
H-128			
H-129			
H130			

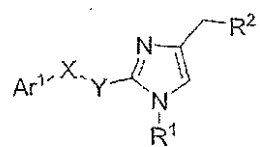
10

20

【 0 3 2 1 】

【表 2 7 1】

表 H-1B



Cpd No.	Ar ¹ -X-Y	R ¹	R ²
H-131			
H-132			
H-133			
H-134			
H-135			
H-136			

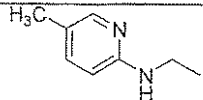
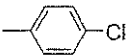
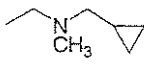
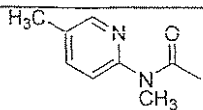
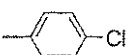
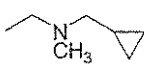
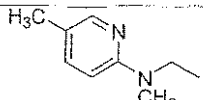
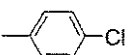
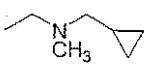
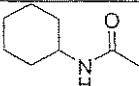
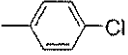
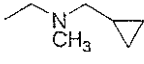
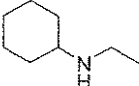
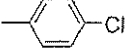
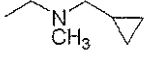
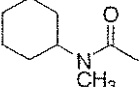
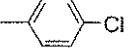
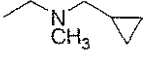
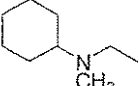
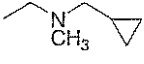
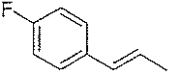
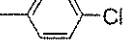
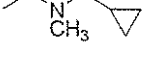
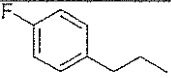
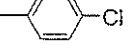
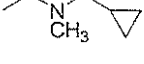
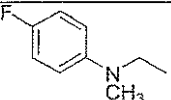
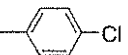
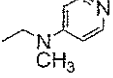
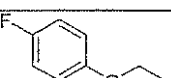
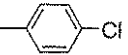
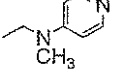
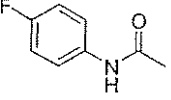
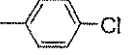
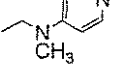
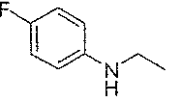
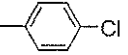
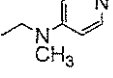
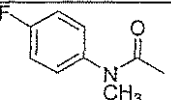
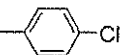
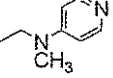
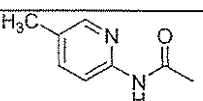
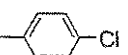
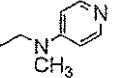
10

20

【0 3 2 2】

30

【表 2 7 2】

H-137			
H-138			
H-139			
H-140			
H-141			
H-142			
H-143			
H-144			
H-145			
H-146			
H-147			
H-148			
H-149			
H-150			
H-151			

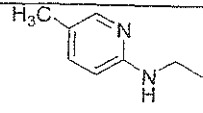
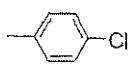
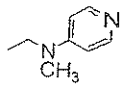
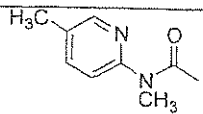
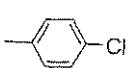
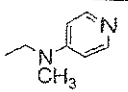
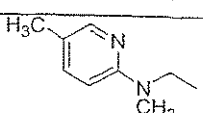
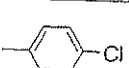
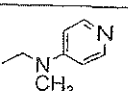
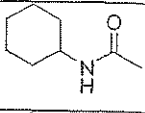
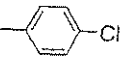
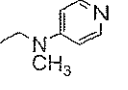
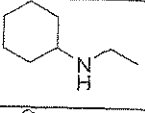
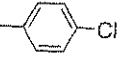
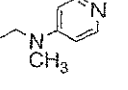
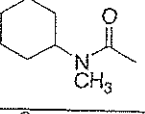
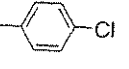
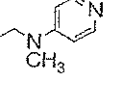
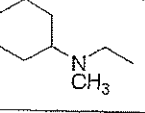
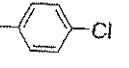
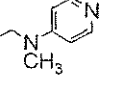
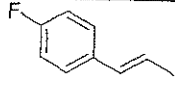
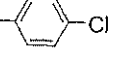
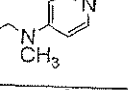
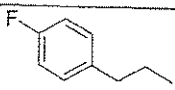
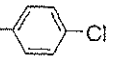
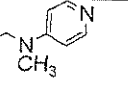
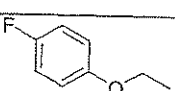
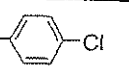
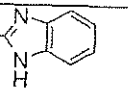
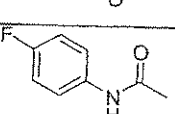
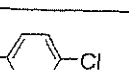
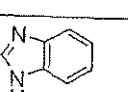
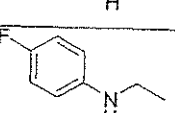
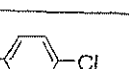
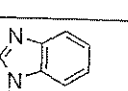
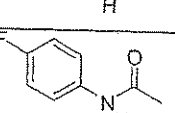
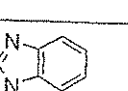
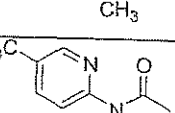
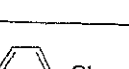
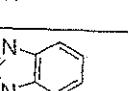
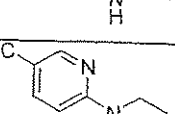
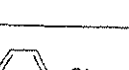
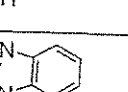
10

20

30

40

【表 2 7 3】

H-152			
H-153			
H-154			
H-155			
H-156			
H-157			
H-158			
H-159			
H-160			
H-161			
H-162			
H-163			
H-164			
H-165			
H-166			

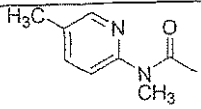
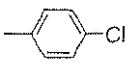
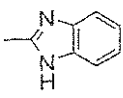
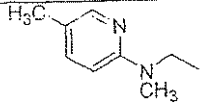
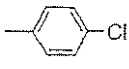
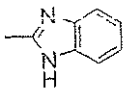
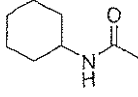
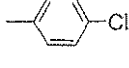
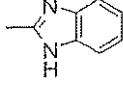
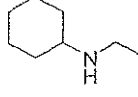
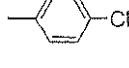
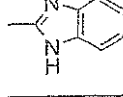
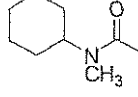
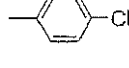
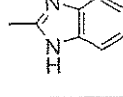
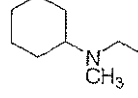
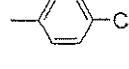
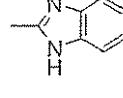
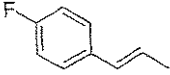
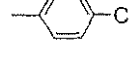
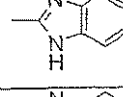
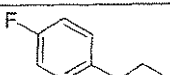
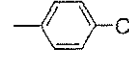
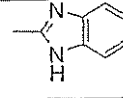
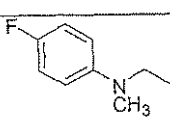
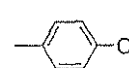
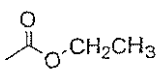
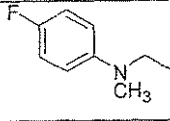
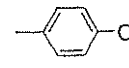
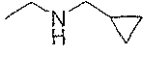
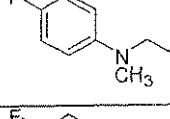
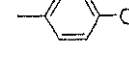
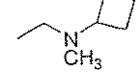
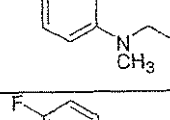
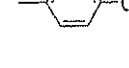
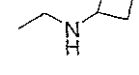
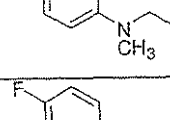
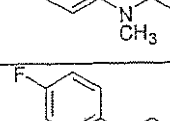
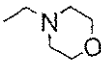
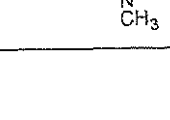
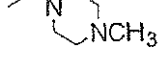
10

20

30

40

【表 2 7 4】

H-167			
H-168			
H-169			
H-170			
H-171			
H-172			
H-173			
H-174			
H-175			
H-176			
H-177			
H-178			
H-179			
H-180			
H-181			

10

20

30

40

【表 2 7 5】

H-182			
H-183			
H-184			
H-185			
H-186			
H-187			
H-188			
H-189			
H-190			
H-191			
H-192			
H-193			
H-194			
H-195			

10

20

30

40

【表 2 7 6】

H-196			
H-197			
H-198			
H-199			
H-200			
H-201			
H-202			
H-203			
H-204			
H-205			
H-206			
H-207			
H-208			
H-209			

10

20

30

40

【表 2 7 7】

H-210			
H-211			
H-212			
H-213			
H-214			
H-215			
H-216			
H-217			
H-218			
H-219			
H-220			
H-221			
H-222			
H-223			

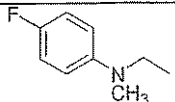
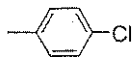
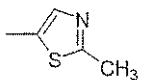
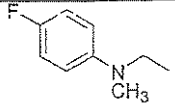
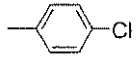
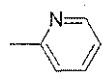
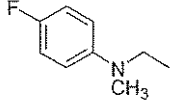
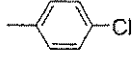
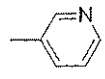
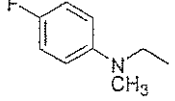
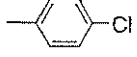
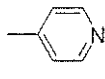
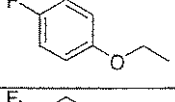
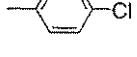
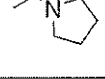
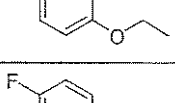
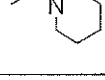
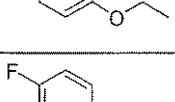
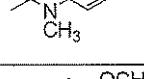
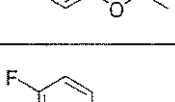
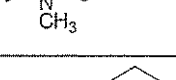
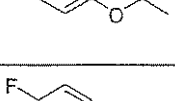
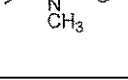
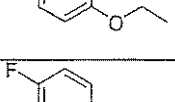
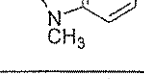
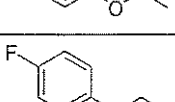
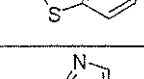
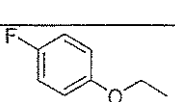
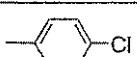
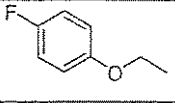
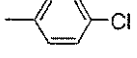
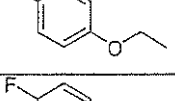
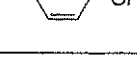
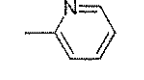
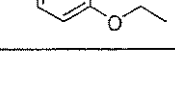
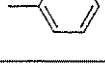
10

20

30

40

【表 2 7 8】

H-224			
H-225			
H-226			
H-227			
H-228			
H-229			
H-230			
H-231			
H-232			
H-233			
H-234			
H-235			
H-236			
H-237			
H-238			
H-239			

10

20

30

40

【表 2 7 9】

H-240			
H-241			
H-242			
H-243		CH ₃	
H-244			
H-245			
H-246			
H-247			
H-248			
H-249		CH ₃	
H-250			
H-251			
H-252			
H-253			

10

20

30

40

【表 280】

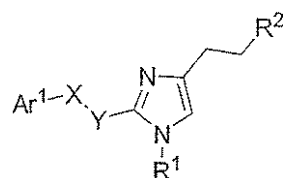
H-254		CH ₃	
H-255			
H-256			
H257			

10

【0331】

【表 281】

表 H-1C



20

Cpd No.	Ar ¹ -X-Y	R ¹	R ²
H-258			
H-259			
H-260			
H-261			
H-262			
H-263			
H-264			

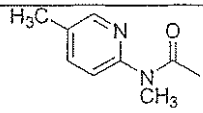
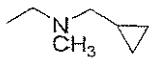
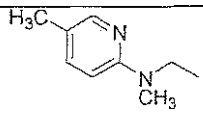
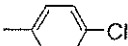
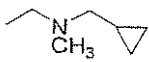
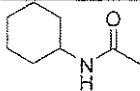
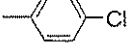
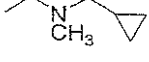
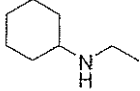
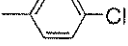
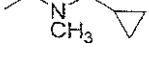
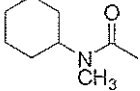
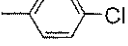
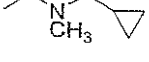
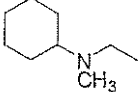
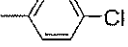
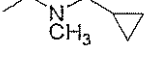
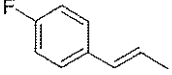
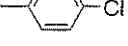
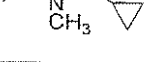
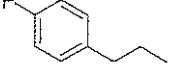
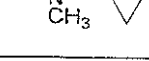
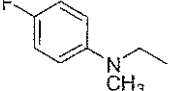
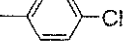
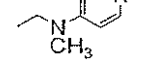
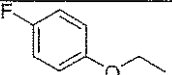
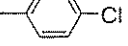
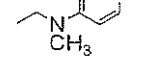
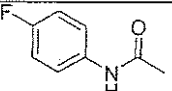
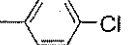
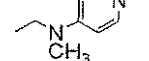
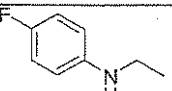
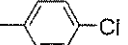
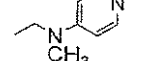
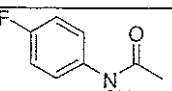
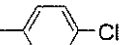
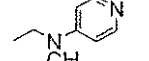
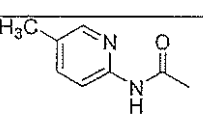
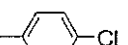
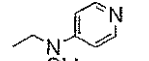
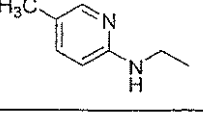
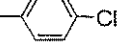
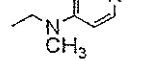
30

40

50

【 0 3 3 2 】

【 表 2 8 2 】

H-265			
H-266			
H-267			
H-268			
H-269			
H-270			
H-271			
H-272			
H-273			
H-274			
H-275			
H-276			
H-277			
H-278			
H-279			

10

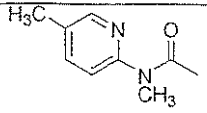
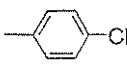
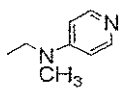
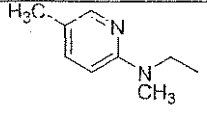
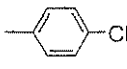
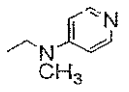
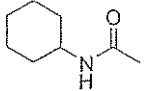
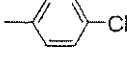
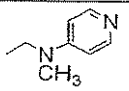
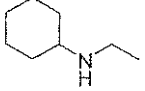
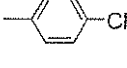
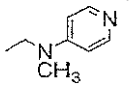
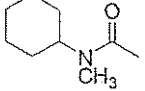
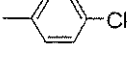
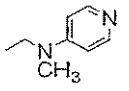
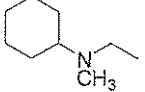
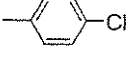
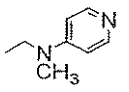
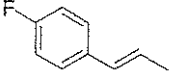
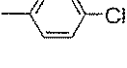
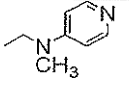
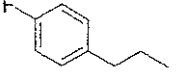
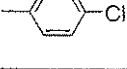
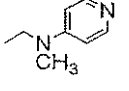
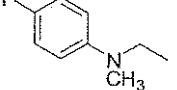
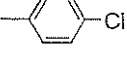
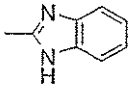
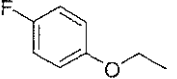
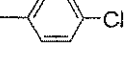
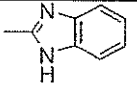
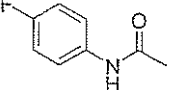
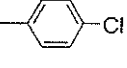
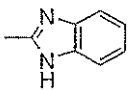
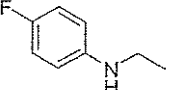
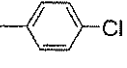
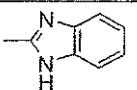
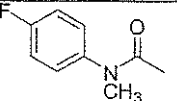
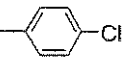
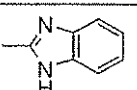
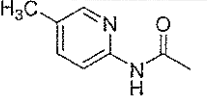
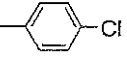
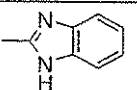
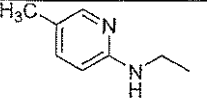
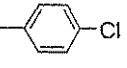
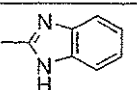
20

30

40

【 0 3 3 3 】

【表 2 8 3】

H-280			
H-281			
H-282			
H-283			
H-284			
H-285			
H-286			
H-287			
H-288			
H-289			
H-290			
H-291			
H-292			
H-293			
H-294			

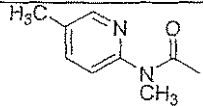
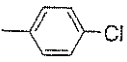
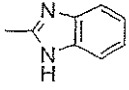
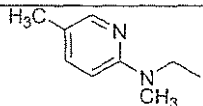
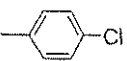
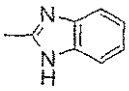
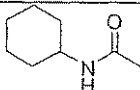
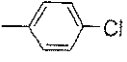
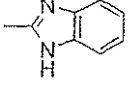
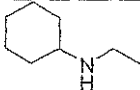
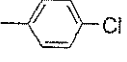
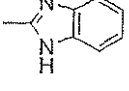
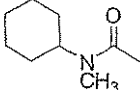
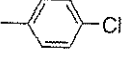
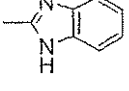
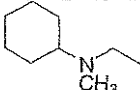
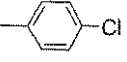
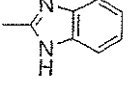
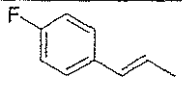
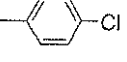
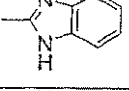
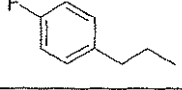
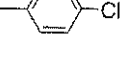
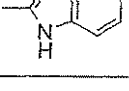
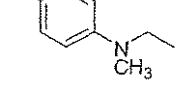
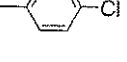
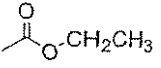
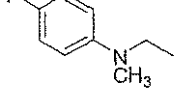
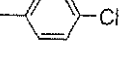
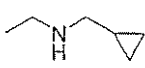
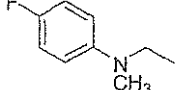
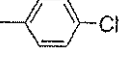
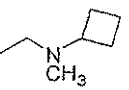
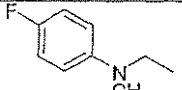
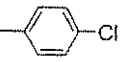
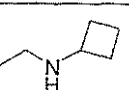
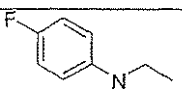
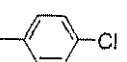
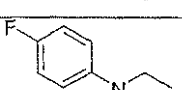
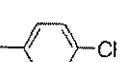
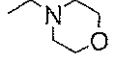
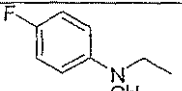
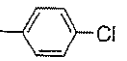
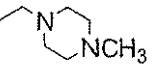
10

20

30

40

【表 2 8 4】

H-295			
H-296			
H-297			
H-298			
H-299			
H-300			
H-301			
H-302			
H-303			
H-304			
H-305			
H-306			
H-307			
H-308			
H-309			

10

20

30

40

【表 285】

H-310			
H-311			
H-312			
H-313			
H-314			
H-315			
H-316			
H-317			
H-318			
H-319			
H-320			
H-321			
H-322			
H-323			

10

20

30

40

【表 286】

H-324			
H-325			
H-326			
H-327			
H-328			
H-329			
H-330			
H-331			
H-332			
H-333			
H-334			
H-335			
H-336			
H-337			

10

20

30

40

【表 287】

H-338			
H-339			
H-340			
H-341			
H-342			
H-343			
H-344			
H-345			
H-346			
H-347			
H-348			
H-349			
H-350			
H-351			

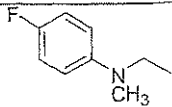
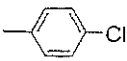
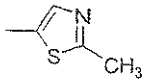
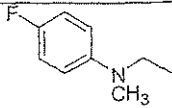
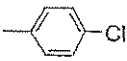
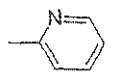
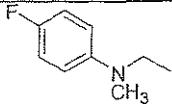
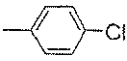
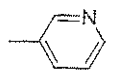
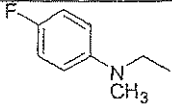
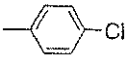
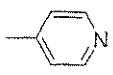
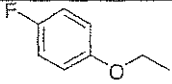
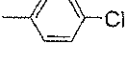
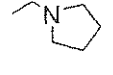
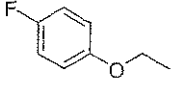
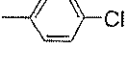
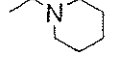
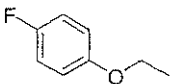
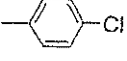
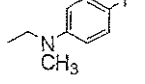
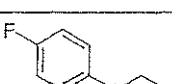
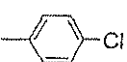
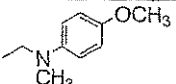
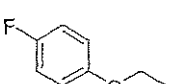
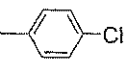
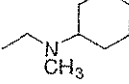
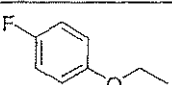
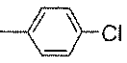
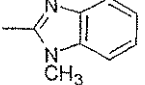
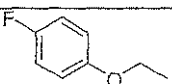
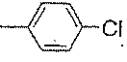
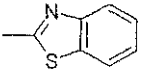
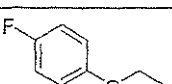
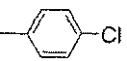
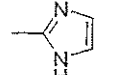
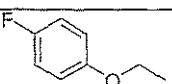
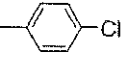
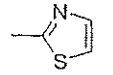
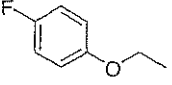
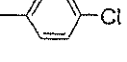
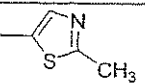
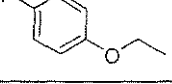
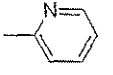
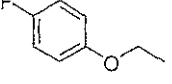
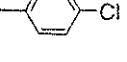
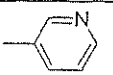
10

20

30

40

【表 2 8 8】

H-352			
H-353			
H-354			
H-355			
H-356			
H-357			
H-358			
H-359			
H-360			
H-361			
H-362			
H-363			
H-364			
H-365			
H-366			
H-367			

10

20

30

40

【表 2 8 9】

H-368			
H-369			
H-370			
H-371		CH ₃	
H-372			
H-373			
H-374			
H-375			
H-376			
H-377		CH ₃	
H-378			
H-379			
H-380			
H-381			

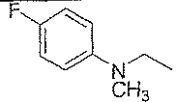
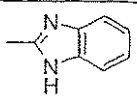
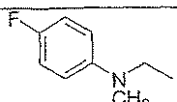
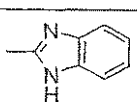
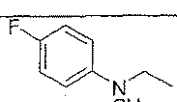
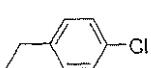
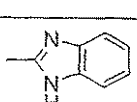
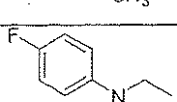
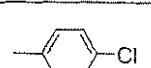
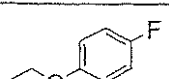
10

20

30

40

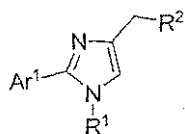
【表 2 9 0】

H-382		CH_3	
H-383			
H-384			
H385			

【 0 3 4 1 】

【表 2 9 1】

表 J-1A



Cpd no.	Ar ¹	R ¹	R ²
J-1			
J-2			
J-3			
J-4			
J-5			
J-6			
J-7			
J-8			
J-9			

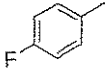
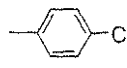
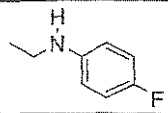
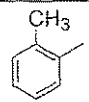
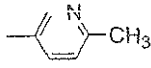
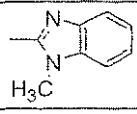
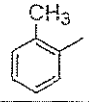
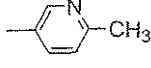
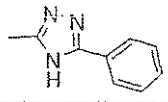
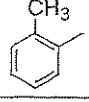
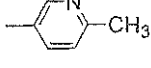
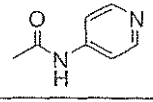
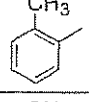
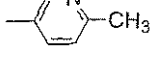
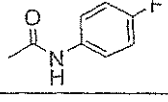
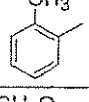
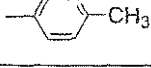
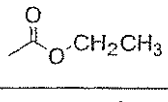
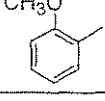
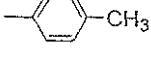
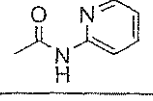
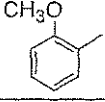
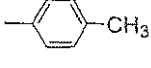
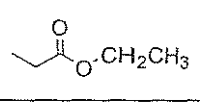
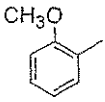
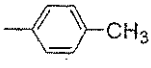
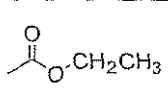
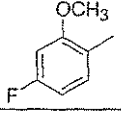
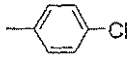
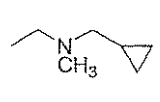
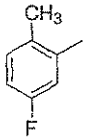
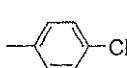
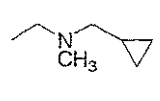
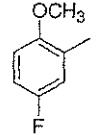
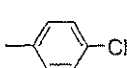
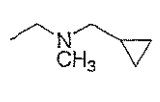
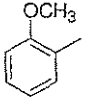
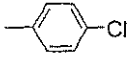
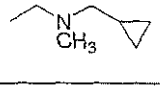
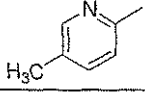
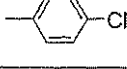
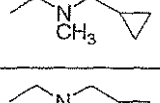
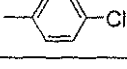
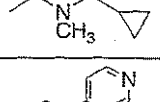
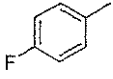
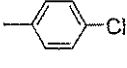
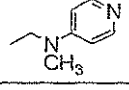
10

20

30

【0 3 4 2】

【表 2 9 2】

J-10			
J-11			
J-12			
J-13			
J-14			
J-15			
J-16			
J-17			
J-18			
J-19			
J-20			
J-21			
J-22			
J-23			
J-24			
J-25			

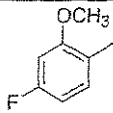
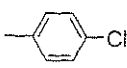
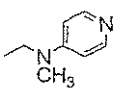
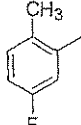
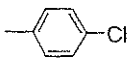
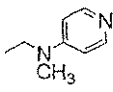
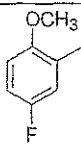
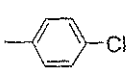
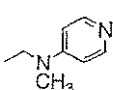
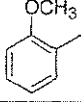
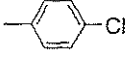
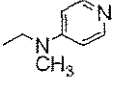
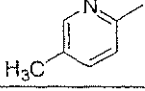
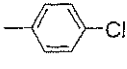
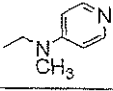
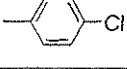
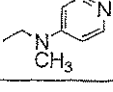
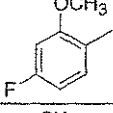
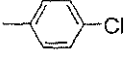
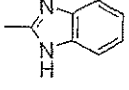
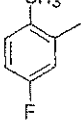
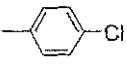
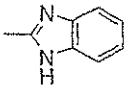
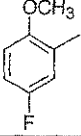
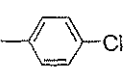
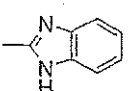
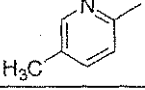
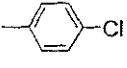
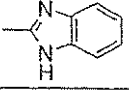
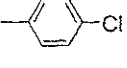
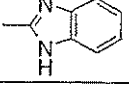
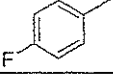
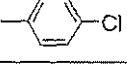
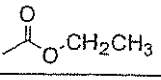
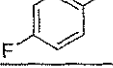
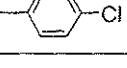
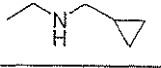
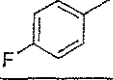
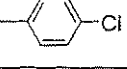
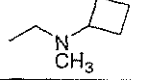
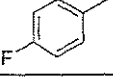
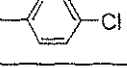
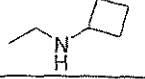
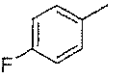
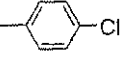
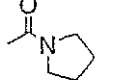
10

20

30

40

【表 2 9 3】

J-26			
J-27			
J-28			
J-29			
J-30			
J-31			
J-32			
J-33			
J-34			
J-35			
J-36			
J-37			
J-38			
J-39			
J-40			
J-41			

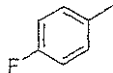
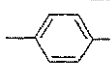
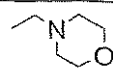
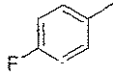
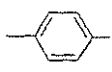
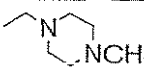
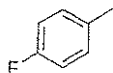
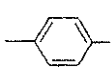
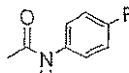
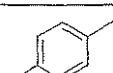
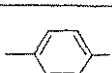
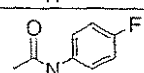
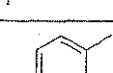
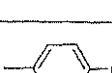
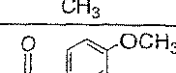
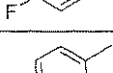
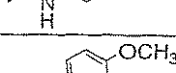
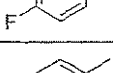
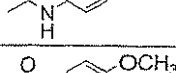
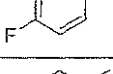
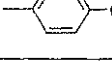
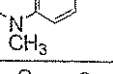
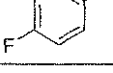
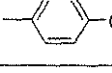
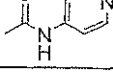
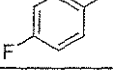
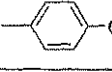
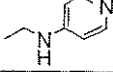
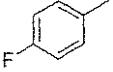
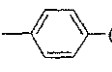
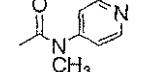
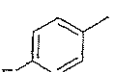
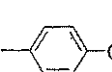
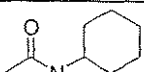
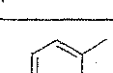
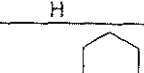
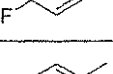
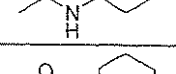
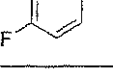
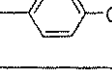
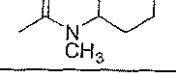
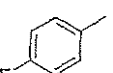
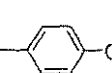
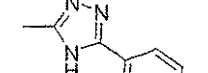
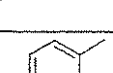
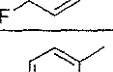
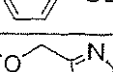
10

20

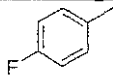
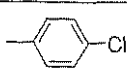
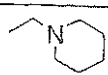
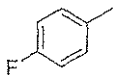
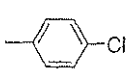
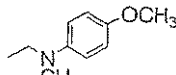
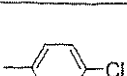
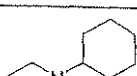
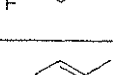
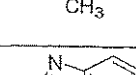
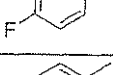
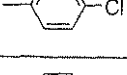
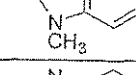
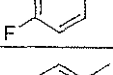
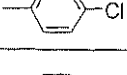
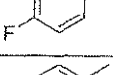
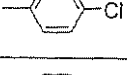
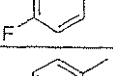
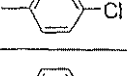
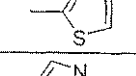
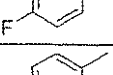
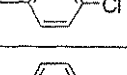
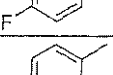
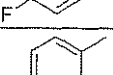
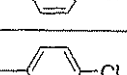
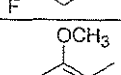
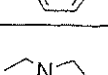
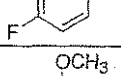
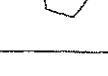
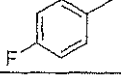
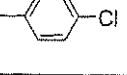
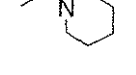
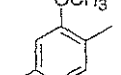
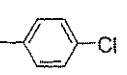
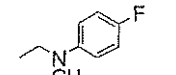
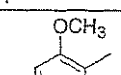
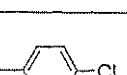
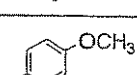
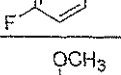
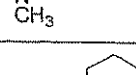
30

40

【表 2 9 4】

J-42			
J-43			
J-44			
J-45			
J-46			
J-47			
J-48			
J-49			
J-50			
J-51			
J-52			
J-53			
J-54			
J-55			
J-56			
J-57			
J-58			
J-59			

【表 2 9 5】

J-60			
J-61			
J-62			
J-63			
J-64			
J-65			
J-66			
J-67			
J-68			
J-69			
J-70			
J-71			
J-72			
J-73			
J-74			
J-75			
J-76			

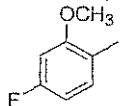
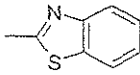
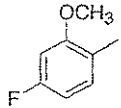
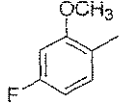
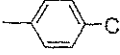
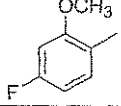
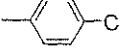
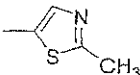
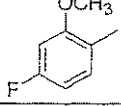
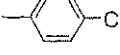
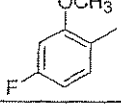
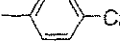
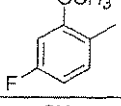
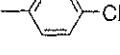
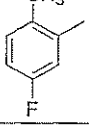
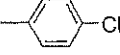
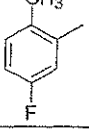
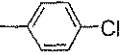
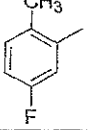
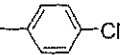
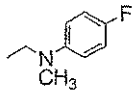
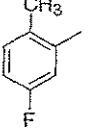
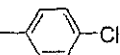
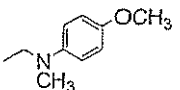
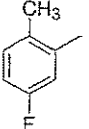
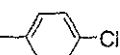
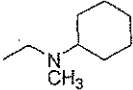
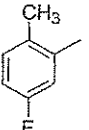
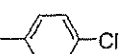
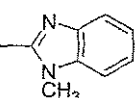
10

20

30

40

【表 2 9 6】

J-77			
J-78			
J-79			
J-80			
J-81			
J-82			
J-83			
J-84			
J-85			
J-86			
J-87			
J-88			
J-89			

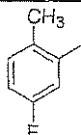
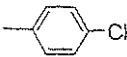
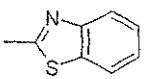
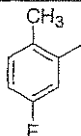
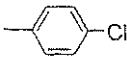
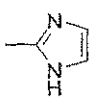
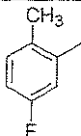
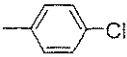
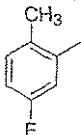
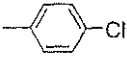
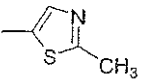
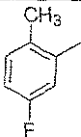
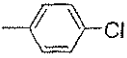
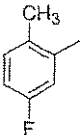
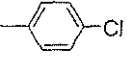
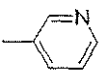
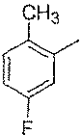
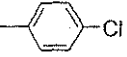
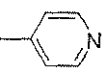
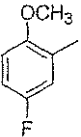
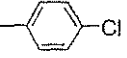
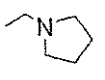
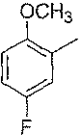
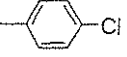
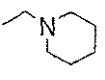
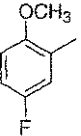
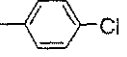
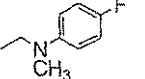
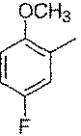
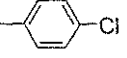
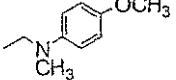
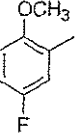
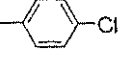
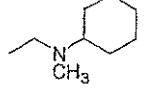
10

20

30

40

【表 2 9 7】

J-90			
J-91			
J-92			
J-93			
J-94			
J-95			
J-96			
J-97			
J-98			
J-99			
J-100			
J-101			

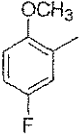
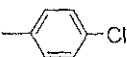
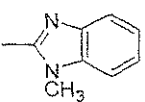
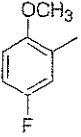
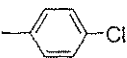
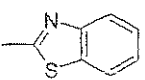
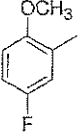
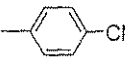
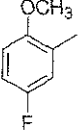
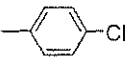
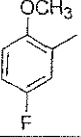
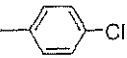
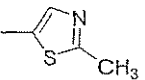
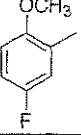
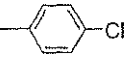
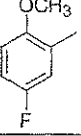
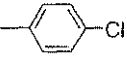
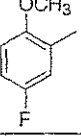
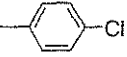
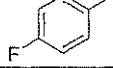
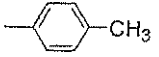
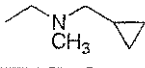
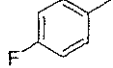
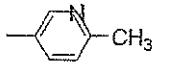
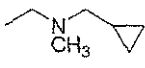
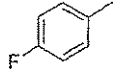
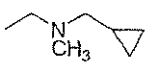
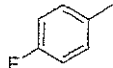
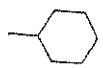
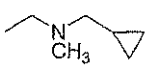
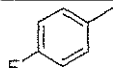
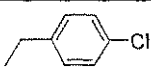
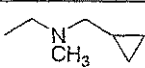
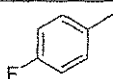
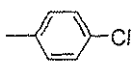
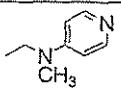
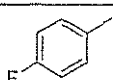
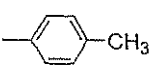
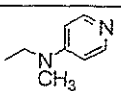
10

20

30

40

【表 2 9 8】

J-102			
J-103			
J-104			
J-105			
J-106			
J-107			
J-108			
J-109			
J-110			
J-111			
J-112			
J-113			
J-114			
J-115			
J-116			

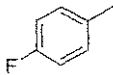
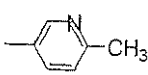
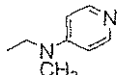
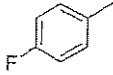
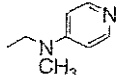
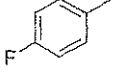
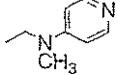
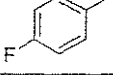
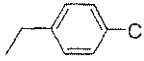
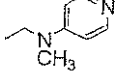
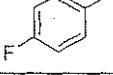
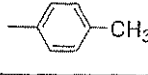
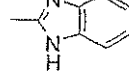
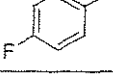
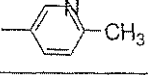
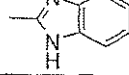
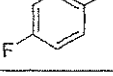
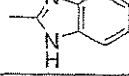
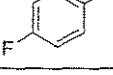
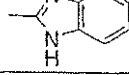
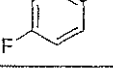
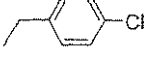
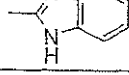
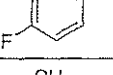
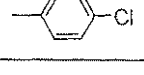
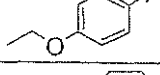
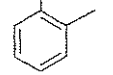
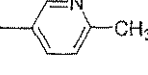
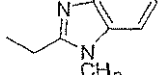
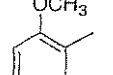
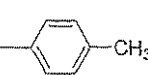
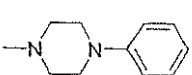
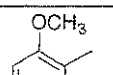
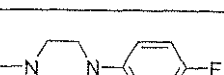
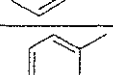
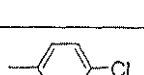
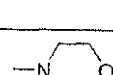
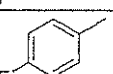
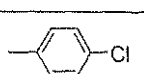
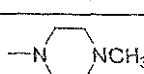
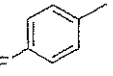
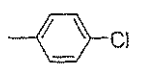
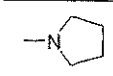
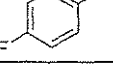
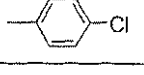
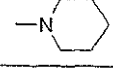
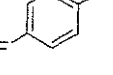
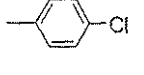
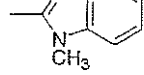
10

20

30

40

【表 2 9 9】

J-117			
J-118		CH ₃	
J-119			
J-120			
J-121			
J-122			
J-123		CH ₃	
J-124			
J-125			
J-126			
J-127			
J-128			
J-129			
J-130			
J-131			
J-132			
J-133			
J-134			

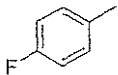
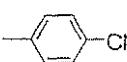
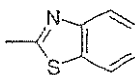
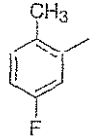
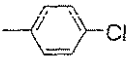
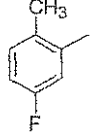
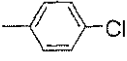
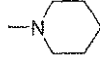
10

20

30

40

【表 3 0 0】

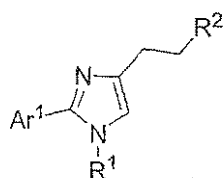
J-135			
J-136			
J-137			

10

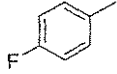
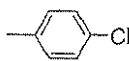
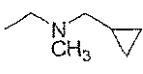
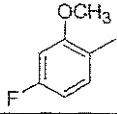
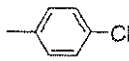
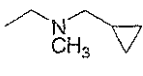
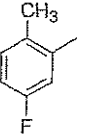
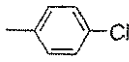
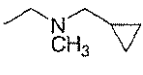
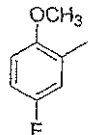
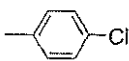
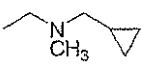
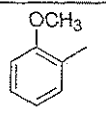
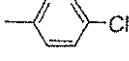
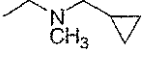
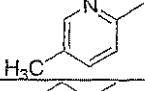
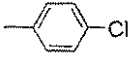
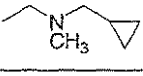
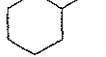
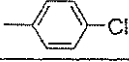
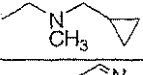
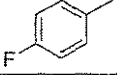
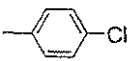
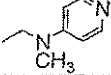
【 0 3 5 1】

【表 3 0 1】

表 J-1B



20

Cpd no.	Ar ¹	R ¹	R ²
J-138			
J-139			
J-140			
J-141			
J-142			
J-143			
J-144			
J-145			

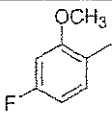
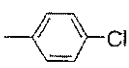
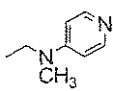
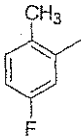
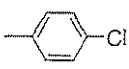
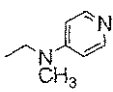
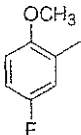
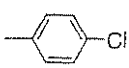
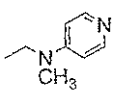
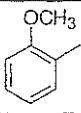
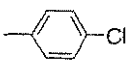
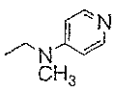
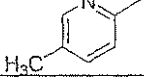
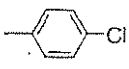
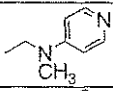
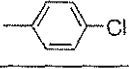
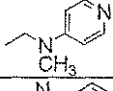
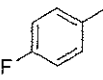
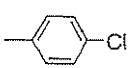
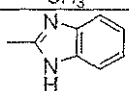
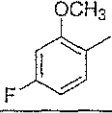
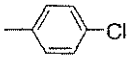
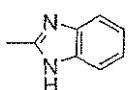
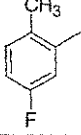
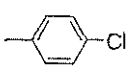
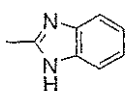
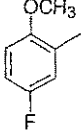
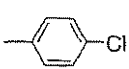
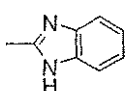
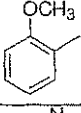
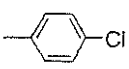
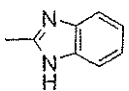
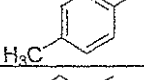
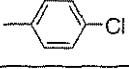
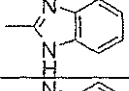
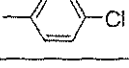
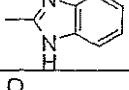
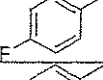
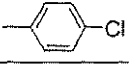
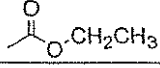
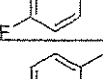
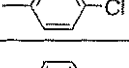
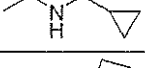
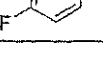
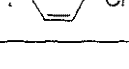
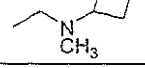
30

40

【 0 3 5 2】

50

【表 3 0 2】

J-146			
J-147			
J-148			
J-149			
J-150			
J-151			
J-152			
J-153			
J-154			
J-155			
J-156			
J-157			
J-158			
J-159			
J-160			
J-161			

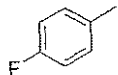
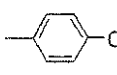
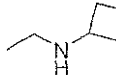
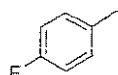
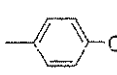
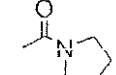
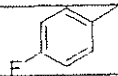
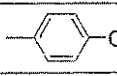
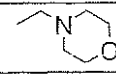
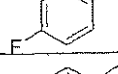
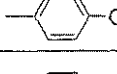
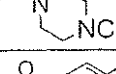
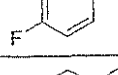
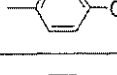
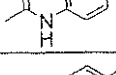
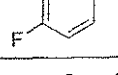
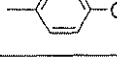
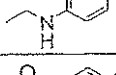
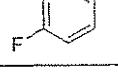
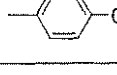
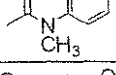
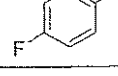
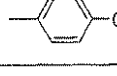
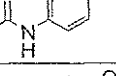
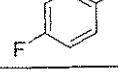
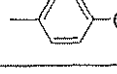
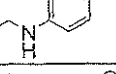
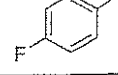
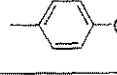
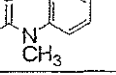
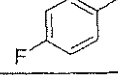
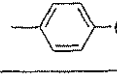
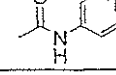
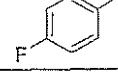
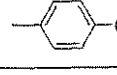
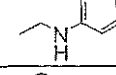
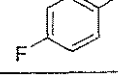
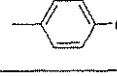
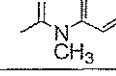
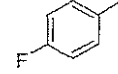
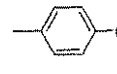
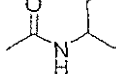
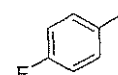
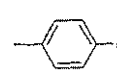
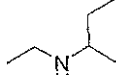
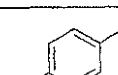
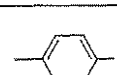
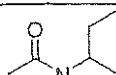
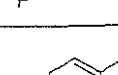
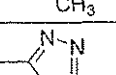
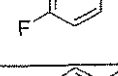
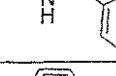
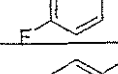
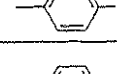
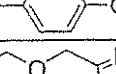
10

20

30

40

【表 3 0 3】

J-162			
J-163			
J-164			
J-165			
J-166			
J-167			
J-168			
J-169			
J-170			
J-171			
J-172			
J-173			
J-174			
J-175			
J-176			
J-177			
J-178			
J-179			
J-180			

10

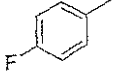
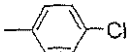
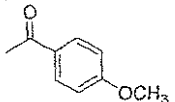
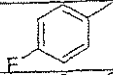
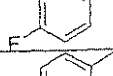
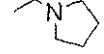
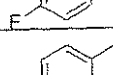
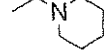
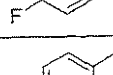
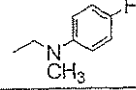
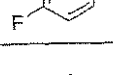
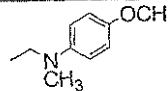
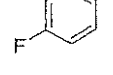
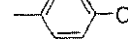
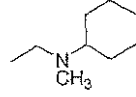
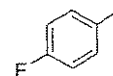
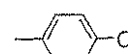
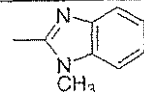
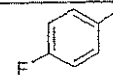
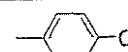
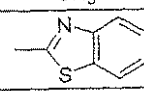
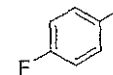
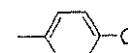
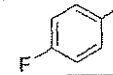
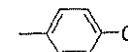
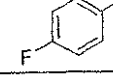
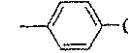
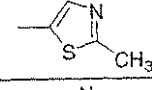
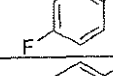
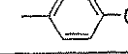
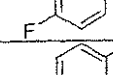
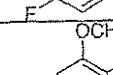
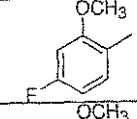
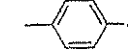
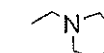
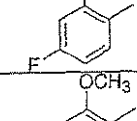
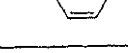
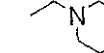
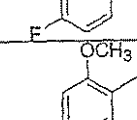
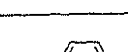
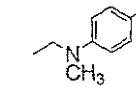
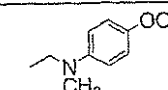
20

30

40

【 0 3 5 4】

【表 3 0 4】

J-181			
J-182			
J-183			
J-184			
J-185			
J-186			
J-187			
J-188			
J-189			
J-190			
J-191			
J-192			
J-193			
J-194			
J-195			
J-196			
J-197			
J-198			
J-199			

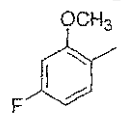
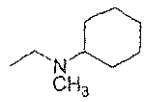
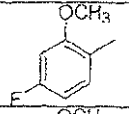
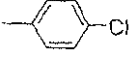
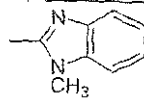
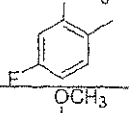
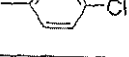
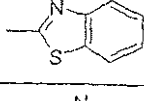
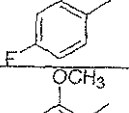
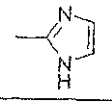
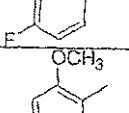
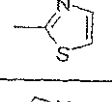
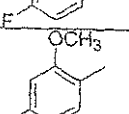
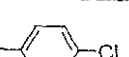
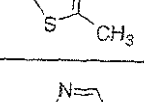
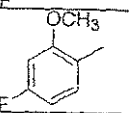
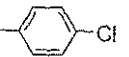
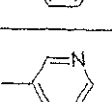
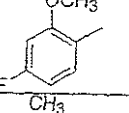
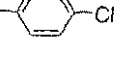
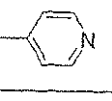
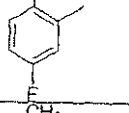
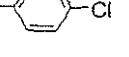
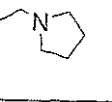
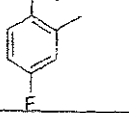
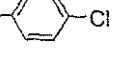
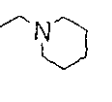
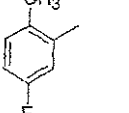
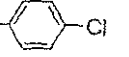
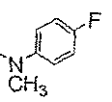
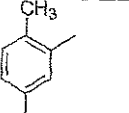
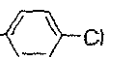
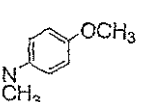
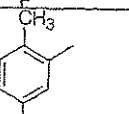
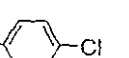
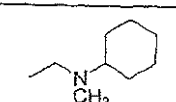
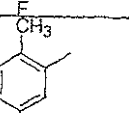
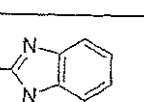
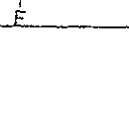
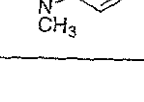
10

20

30

40

【表 3 0 5】

J-200			
J-201			
J-202			
J-203			
J-204			
J-205			
J-206			
J-207			
J-208			
J-209			
J-210			
J-211			
J-212			
J-213			
J-214			

10

20

30

40

【 0 3 5 6 】

50

【表 3 0 6】

J-215			
J-216			
J-217			
J-218			
J-219			
J-220			
J-221			
J-222			
J-223			
J-224			
J-225			
J-226			
J-227			

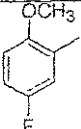
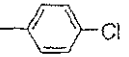
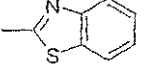
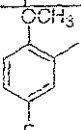
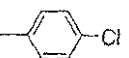
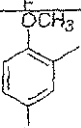
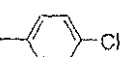
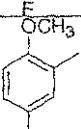
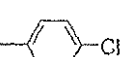
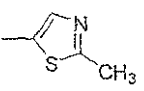
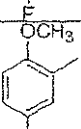
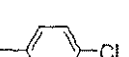
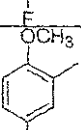
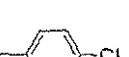
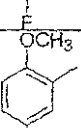
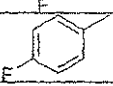
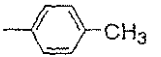
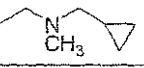
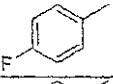
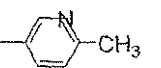
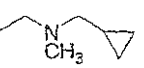
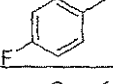
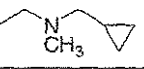
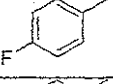
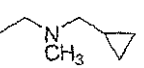
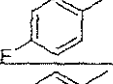
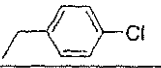
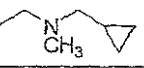
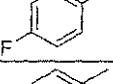
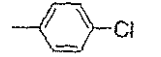
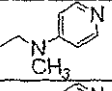
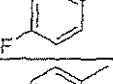
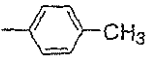
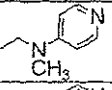
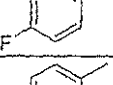
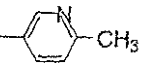
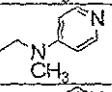
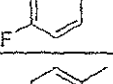
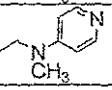
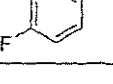
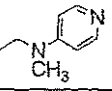
10

20

30

40

【表 3 0 7】

J-228			
J-229			
J-230			
J-231			
J-232			
J-233			
J-234			
J-235			
J-236			
J-237		CH_3	
J-238			
J-239			
J-240			
J-241			
J-242			
J-243		CH_3	
J-244			

10

20

30

40

【表 3 0 8】

J-245			
J-246			
J-247			
J-248		CH ₃	
J-249			
J-250			
J-251			

10

【0 3 5 9】

20

イオンチャネルモジュレーティング化合物は、インビトロ（例えば、細胞および非細胞系）およびインビボ法の両方により同定することができる。これらの方法の代表例を本明細書の実施例において記載する。

本発明により想定される置換基および変数の組み合わせは、結果として安定な化合物が形成されるものだけである。本明細書において用いられる「安定な」なる用語は、製造を可能にするために十分な安定性を有し、本明細書において詳細に記載される目的（例えば、対象者に対する治療的または予防的投与）に関して十分な時間、有用であるために化合物の一体性を維持する化合物を意味する。

【0 3 6 0】

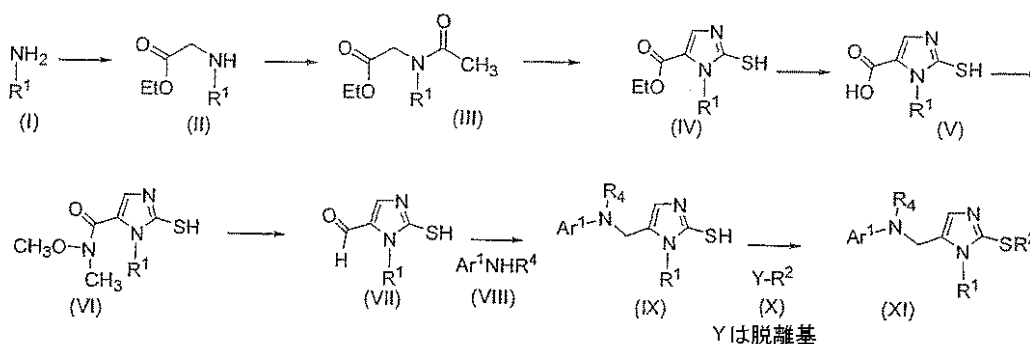
本明細書において示される化合物は、本明細書のスキームにおいて示されるように、通常の方法を用いて合成することができる。本明細書のスキームにおいて、特に記載しない限り、化学式における変数は本明細書の他の式において定義した通りである。例えば、スキームにおける Ar^1 、 Ar^3 、 R^1 、 R^2 、 R^3 および R^4 は、スキームにおいて特に定義する場合を除いては、本明細書における任意の式においてと同様に定義される。

30

【0 3 6 1】

スキーム A 1

【化 1 9】



40

【0 3 6 2】

アミン（I）を、塩基性条件下（例えば、酢酸ナトリウム）、溶媒中、エチルブロモアセテートで処理して、アミノ酸エステル（II）を得る。溶媒中、塩化アセチルで（II）

50

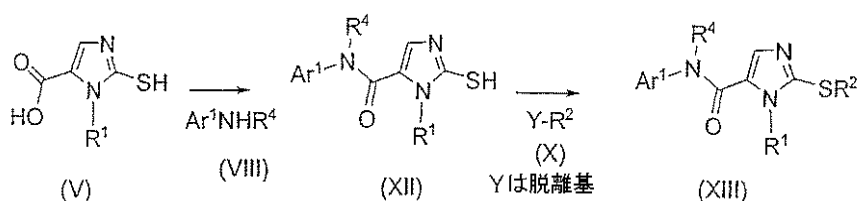
）を処理することにより（ⅠⅠⅠ）を得る。イミダゾール（ⅠⅤ）は、（ⅠⅠⅠ）が溶媒中、塩基性条件下、ギ酸エチルで処理された場合に得られる。エステル（ⅠⅤ）を塩基性条件下で鹼化して、イミダゾール（Ⅴ）を得る。（Ⅴ）をN、O-ジメチルヒドロキシルアミンで、溶媒中、アミド結合形成条件下（例えば、1-エチル-3-（3-ジメチルアミノプロピル）-カルボジイミド塩酸塩）で処理して、アミド（ⅤⅠ）を得る。アミド（ⅤⅠ）を溶媒中、還元条件下（例えば、水素化リチウムアルミニウム）で処理して、アルデヒド（ⅤⅠⅠ）を得る。（ⅤⅠⅠ）をアミン（ⅤⅠⅠⅠ）で、還元条件下（例えば、水素化リチウムアルミニウム、THF）で処理して、（ⅠⅩ）を得る。（ⅠⅩ）を（Ⅹ）で処理して、所望の化合物（ⅩⅠ）を得る。

【0363】

10

スキーム A 2

【化20】



【0364】

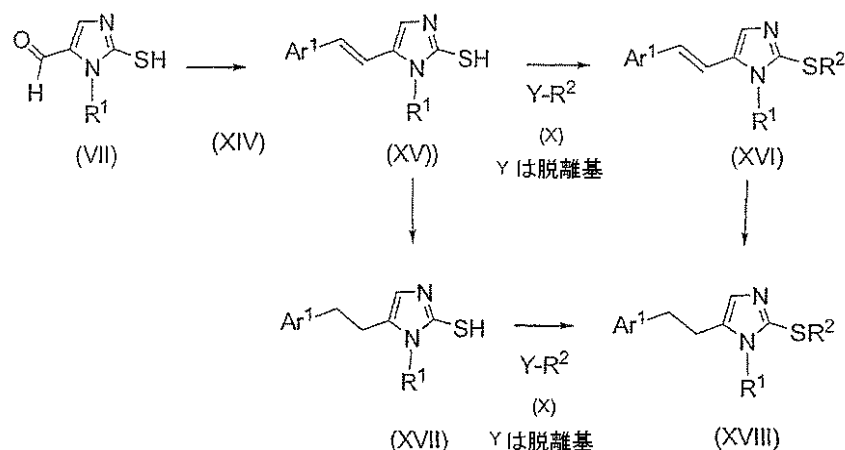
20

カルボン酸（Ⅴ）をアミン（ⅤⅠⅠⅠ）で、アミド結合形成条件下（例えば、1-エチル-3-（3-ジメチルアミノプロピル）-カルボジイミド塩酸塩）、溶媒中で処理して、アミド（ⅩⅠⅠ）を得る。（ⅩⅠⅠ）を（Ⅹ）で、塩基性条件下（例えば、K₂CO₃）、溶媒中で処理して、（ⅩⅠⅠⅠ）を得る。

【0365】

スキーム A 3

【化21】

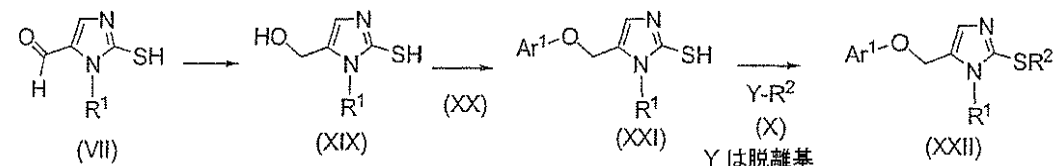


30

【0366】

スキーム A 4

【化22】



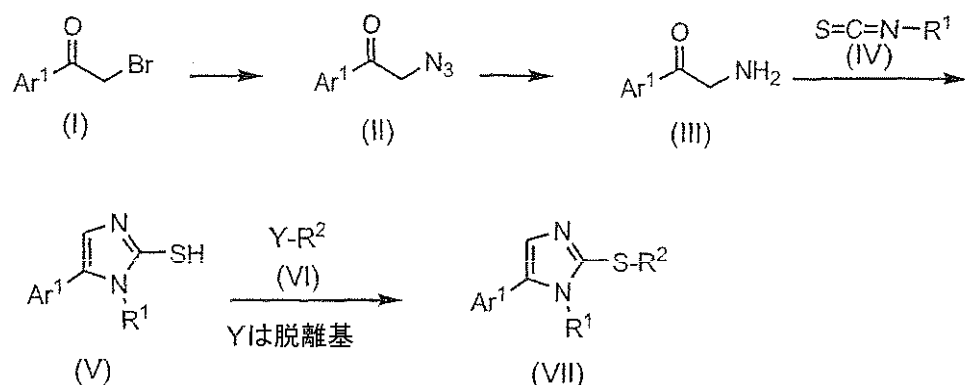
40

【0367】

50

スキーム B 1

【化 2 3】



10

【0368】

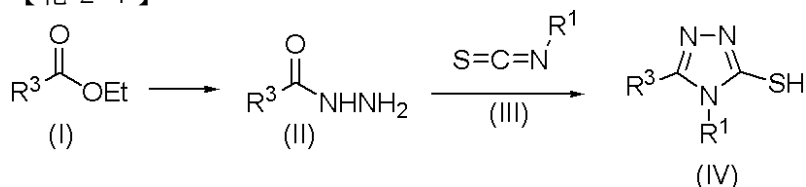
ブロモメチルケトン (I) を、DMSO等の溶媒中、アジ化ナトリウムで処理して、アジドメチルケトン (II) を得る。(II) を、水性HCl中炭素上パラジウムおよびH₂ 雰囲気中などの還元条件下で処理して、アミン (III) を得る。(III) およびイソチオシアネート (IV) を、エタノールなどの溶媒中、炭酸水素ナトリウムなどの塩基性条件下で反応させて、チオイミダゾール (V) を得る。(V) および (VI) を、炭酸カリウムなどの塩基性条件下で反応させて、イミダゾール (VII) を得る。

20

【0369】

スキーム C 1

【化 2 4】



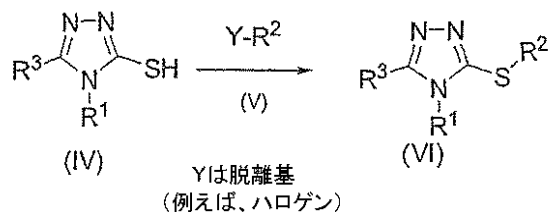
エチルエステル (I) をヒドラジンと溶媒 (例えば、エタノール) 中で処理して、ヒドラジド (II) を得る。(II) をチオイソシアネート (III) で、水性塩基性条件下で処理して、チオール (IV) を得る。

30

【0370】

スキーム C 2

【化 2 5】



40

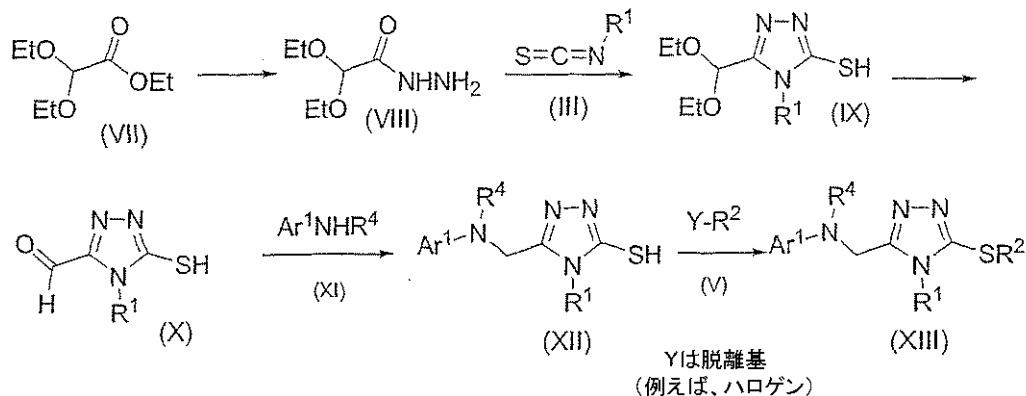
【0371】

(IV) を (V) で塩基性条件下 (例えば、アセトン中K₂CO₃) で処理して、(VI) を得る。

【0372】

スキーム C 3

【化 2 6】



10

【0373】

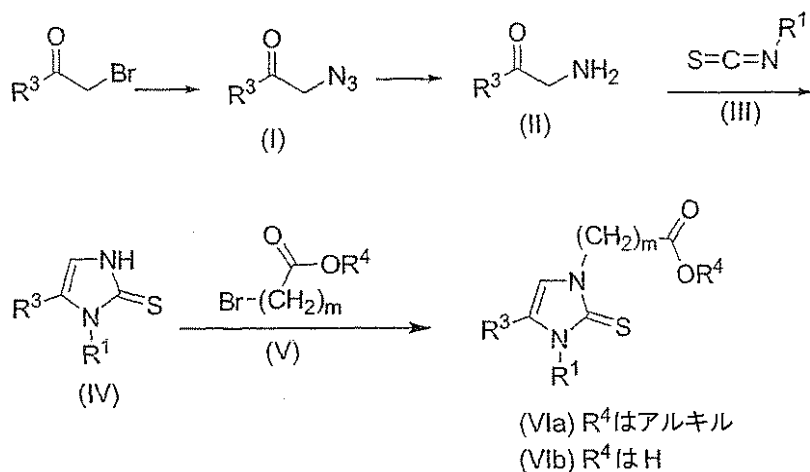
エチルジエトキシアセテート (VII) を溶媒 (例えば、エタノール) 中、ヒドラジンで処理して、ヒドラジド (VIII) を得る。(VIII) をチオイソシアネート (III) で水性塩基性条件下で処理して、トリアゾール (IX) を得、これから、水性酸性条件下での処理により、アルデヒド (X) を得る。(X) を塩基性条件下 (例えば、アセトン中 K_2CO_3)、(V) で処理して、(XII) を得る。

【0374】

20

スキーム D-1

【化 2 7】



30

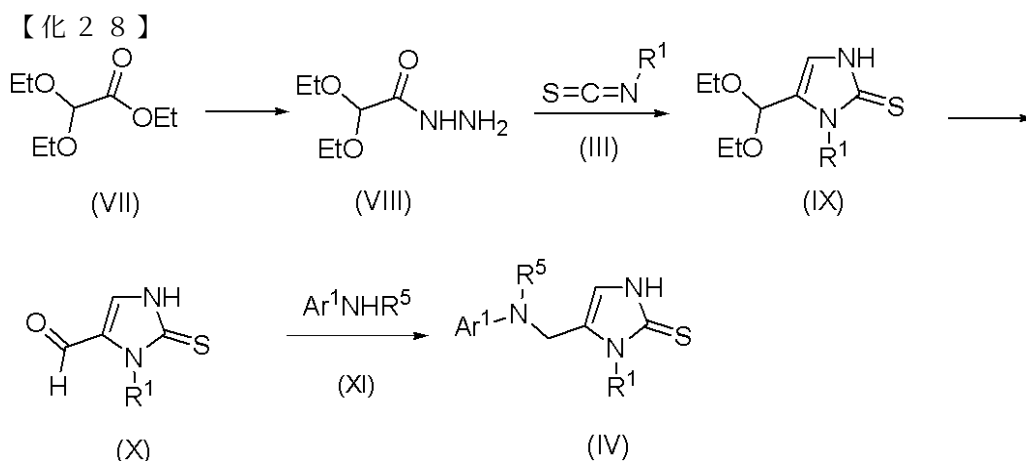
【0375】

ブロモメチル化合物をアジ化ナトリウムで処理して、アジドメチル化合物 (I) を得る。(I) を、水性 HCl 中炭素上パラジウムおよび H_2 雰囲気中などの還元条件下で処理して、アミン (II) を得る。(II) をイソチオシアネート (III) で処理して、イミダゾール (IV) を得る。N-アルキル化イミダゾール (VIa) を、(IV) の 3-ブロモプロピオネート、または 4-ブロモブチレート (V) との反応から調製する。エステル (VIa) の鹼化により、カルボン酸 (VIb) を得る。

40

【0376】

スキーム D-2



10

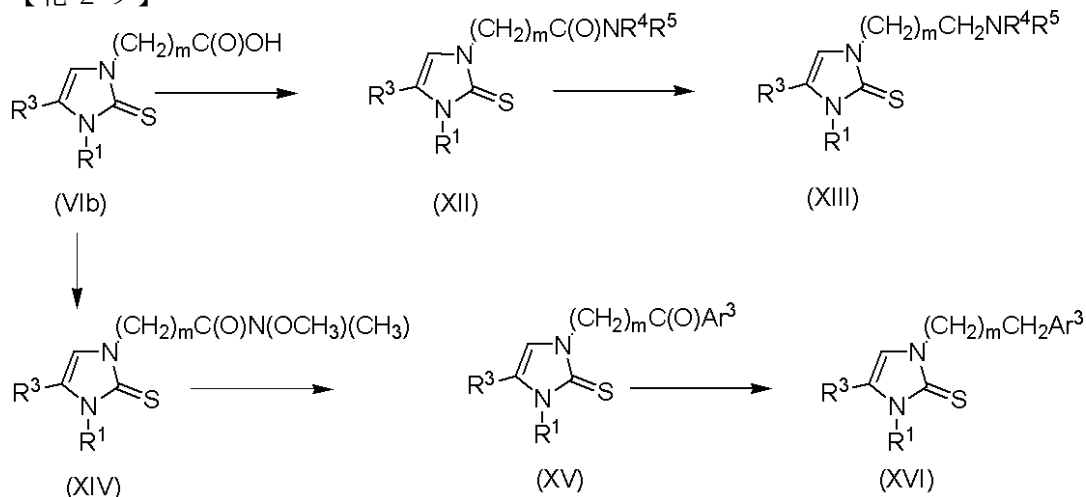
【0377】

別法として、イミダゾール (I V) を、次のシーケンスにより調製する。エチルジエトキシアセテート (V I I) を溶媒 (例えば、エタノール) 中ヒドラジンで処理して、ヒドラジド (V I I I) を得る。(V I I I) をチオイソシアネート (I I I) で、水性塩基性条件下で処理して、イミダゾール (I X) を得、これから、水性酸性条件下でアルデヒド (X) を得る。(X) およびアミン (X I) の還元的アミノ化により、(I V) を得る。

【0378】

スキーム D - 3

【化 2 9】



30

【0379】

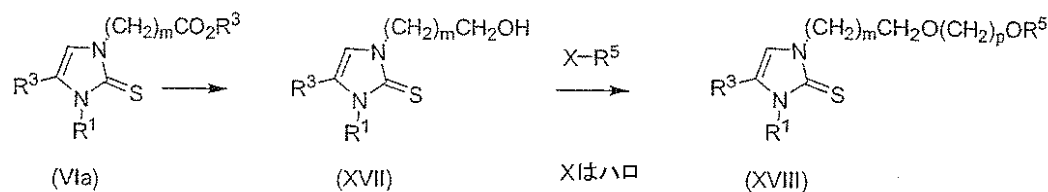
カルボン酸 (V I) を適当に置換されたアミンと、標準的カップリング手順で反応させることにより、所望のアミド (X I I) を得る。アミドを一般的な還元条件下 (例えば、ジボラン、または水素化リチウムアルミニウム) で還元することにより、対応するアミン (X I I I) を得る。別法として、(V I b) を Weinreb の試薬で処理することによりアミド (X I V) を得る。アミド (X I V) を標準的条件下で、有機金属試薬 (例えば、アリールリチウム、またはアリールマグネシウムハライド) で処理することにより、ケトン (X V) を得る。ケトンを経験的な条件下で還元して、所望の生成物 (X V I) を得る。

40

【0380】

スキーム D - 4

【化 3 0】



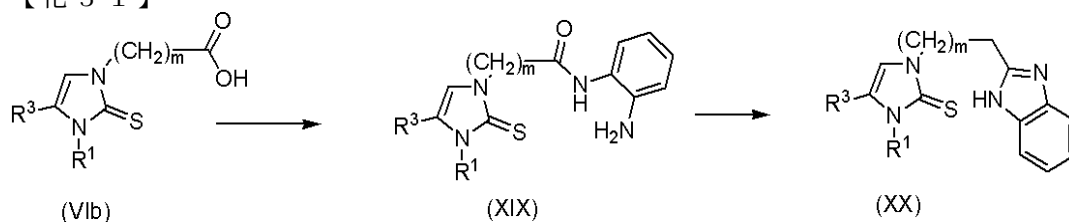
【0 3 8 1】

エステル (V I a) を標準的還元条件下 (例えば、水素化リチウムアルミニウム) で処理して、アルコール (X V I I) を得る。(X V I I) を標準的エーテル形成条件下 (例えば、Na H、ベンジルブロミド) で処理して、(X V I I I) を得る。 10

【0 3 8 2】

スキーム D - 5

【化 3 1】

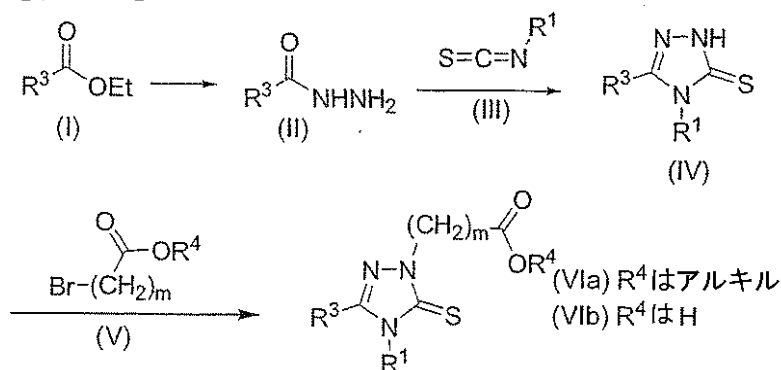


ヘテロアリアル誘導体を得るための別の経路は、(V I b) の活性化された酸を適当な基質と反応させ、続いて環化して、所望の生成物を得ることである。例えば、スキーム D - 5 において示された、(V I b) の活性化された酸のベンゼン - 1, 2 - ジアミンとの反応により、中間体アミン (X I X) を得、これを環化させて、ベンズイミダゾール誘導体 (X X) を得る。 20

【0 3 8 3】

スキーム E - 1

【化 3 2】



30

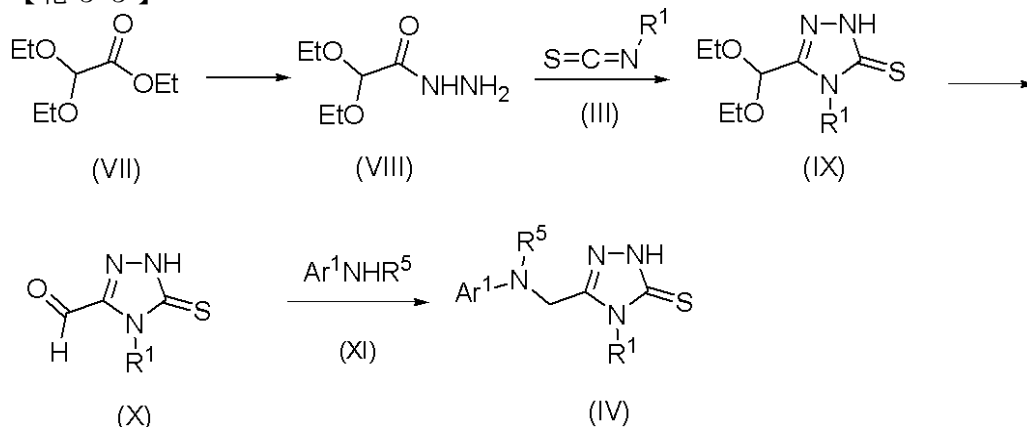
【0 3 8 4】

エチルエステル (I) をヒドラジンで、溶媒 (例えば、エタノール) 中で処理して、ヒドラジド (I I) を得る。(I I) をチオイソシアネート (I I I) で、水性塩基性条件下で処理して、トリアゾールチオン (I V) を得る。N - アルキル化トリアゾール (V I a) は、(I V) の 3 - ブロモ - プロピオネートまたは 4 - ブロモ - ブチレート (V) との反応から調製される。エステル (V I a) の鹼化により、カルボン酸 (V I b) を得る。 40

【0 3 8 5】

スキーム E - 2

【化 3 3】



10

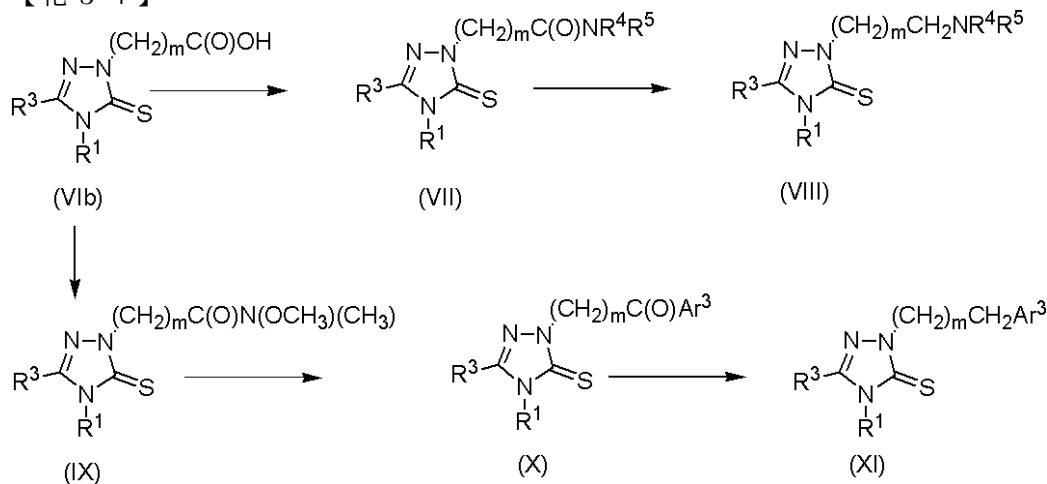
別法として、トリアゾール (I V) を、次のシーケンスにより調製する。エチルジエトキシアセテート (V I I) を溶媒 (例えば、エタノール) 中、ヒドラジンで処理して、ヒドラジド (V I I I) を得る。(V I I) をチオイソシアネート (I I I) で、水性塩基性条件下で処理することにより、トリアゾール (I X) を得、これから、水性酸性条件下でアルデヒド (X) を得る。(X) およびアミン (X I) の還元的アミノ化により、(I V) を得る。

【0 3 8 6】

スキーム E - 3

20

【化 3 4】



30

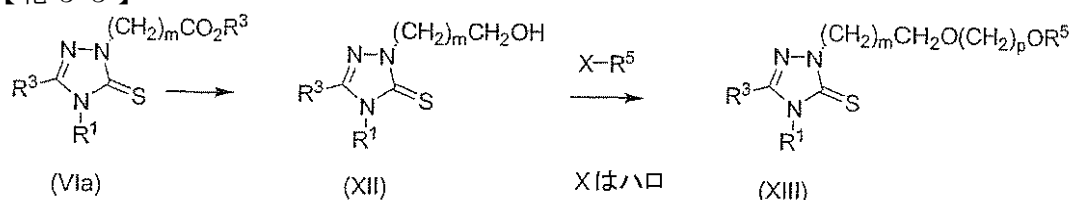
カルボン酸 (V I b) を、適当に置換されたアミンと、標準的カップリング手順で反応させることにより、所望のアミド (V I I) を得る。アミドを一般的な還元条件下 (例えば、ジボラン、または水素化リチウムアルミニウム) で還元して、対応するアミン (V I I I) を得る。別法として、(V I b) を Weinreb の試薬で処理して、アミド (I X) を得る。アミド (I X) を標準的条件下で、有機金属試薬 (例えば、アリールリチウムまたはアリールマグネシウムハライド) で処理して、ケトン (X) を得る。ケトンを経験的な条件下で還元して、所望の生成物 (X I) を得る。

40

【0 3 8 7】

スキーム E - 4

【化 3 5】



50

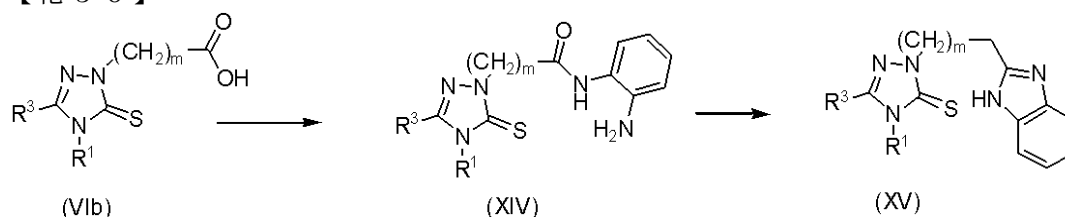
【0388】

エステル(VIa)を標準的還元条件下(例えば、水素化リチウムアルミニウム)で処理して、アルコール(XII)を得る。(XII)を標準的エーテル形成条件下(例えば、NaH、ベンジルプロミド)で処理して、(XIII)を得る。

【0389】

スキームE-5

【化36】



10

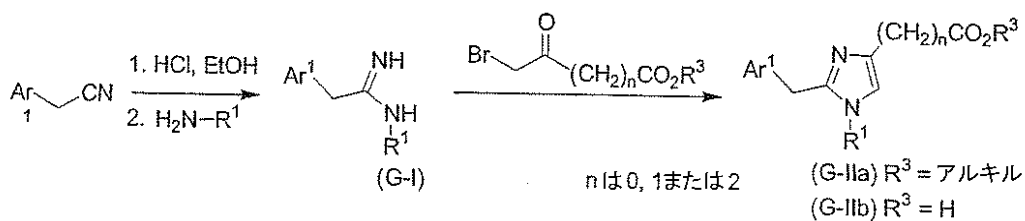
【0390】

ヘテロアリール誘導体を得るための別の経路は、(VIb)の活性化された酸を適当な基質と反応させ、続いて環化させることにより、所望の生成物を得ることである。例えば、スキームE-5に示されるように、(VIb)の活性化された酸のベンゼン-1,2-ジアミンとの反応により、中間体アミド(XIV)を得、これを環化させて、ベンズイミダゾール誘導体(XV)を得る。

【0391】

スキームG-1

【化37】



20

【0392】

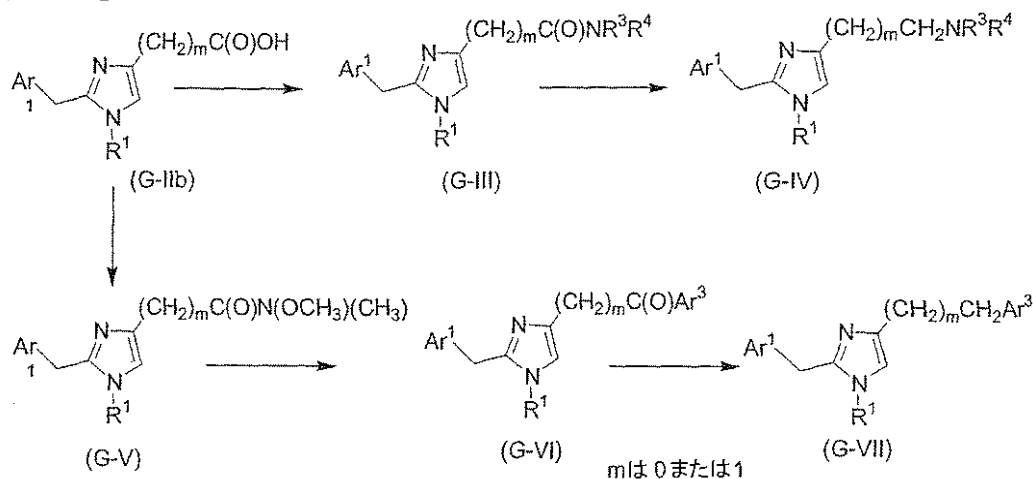
アリールニトリルをアルコールで、酸性条件下で処理することにより、アルコキシイミデートを得、これを適当な置換アミンで、触媒条件下(例えば、エタノール性HCl; CuCl; Ln(III)イオン)で処理して、置換されたアミジン(G-I)を得る。アミジン(G-I)をブロモピルベートまたは4-ブロモ-3-オキソ-2-ブチレートまたは5-ブロモ-3-オキソ-ペンタノエートで塩基性条件下で処理して、イミダゾールエステル(G-IIa)を得、これを加水分解して、対応する酸誘導体(G-IIb)を得る。

【0393】

スキームG-2

30

【化 3 8】



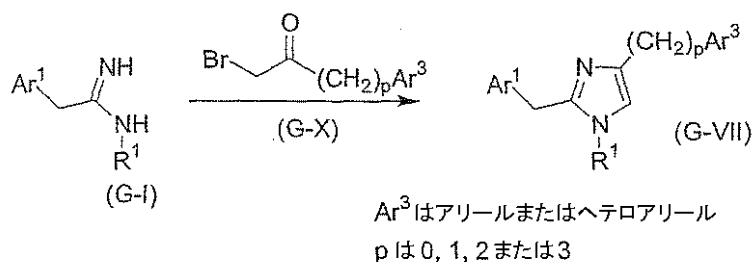
【 0 3 9 4 】

酸 (G-I I b) を適当に置換されたアミンと標準的カップリング手順で反応させて、所望のアミド (G-I I I) を得る。アミドを一般的還元剤、例えば、ジボランまたは水素化リチウムアルミニウムで還元して、対応するアミン (G-I V) を得る。別法として、酸 (G-I I b) を *Weinreb* の試薬で処理して、アミド (G-V) を得る。アミドを標準的条件下、有機金属試薬 (例えば、アリールリチウムまたはアリールマグネシウムハライド) で処理して、ケトン (G-V I) を得る。ケトンを様々な条件下で還元して、所望の生成物 (G-V I I) を得る。

【 0 3 9 5 】

スキーム G-3

【化 3 9】

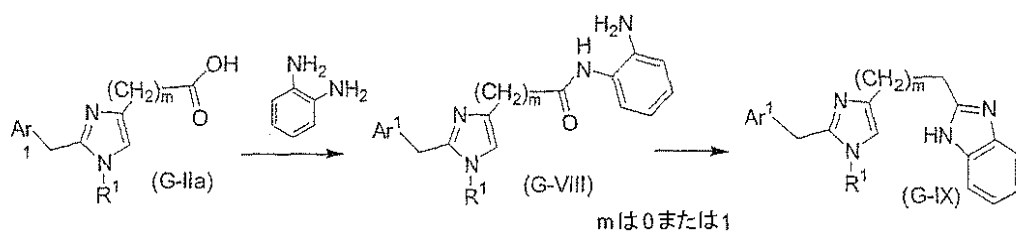


別法として、アミジン（G-I）を（G-X）で処理して、所望のイミダゾール（G-VII）を得る。

【 0 3 9 6 】

スキーム G-4

【化 4 0】



【 0 3 9 7 】

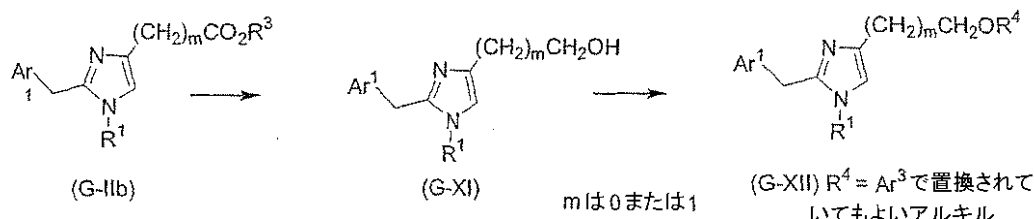
ヘテロアリアル誘導体を得るための別の経路は、(G-I I b)の活性化された酸を適当な基質と反応させ、続いて環化することにより、所望の生成物を得ることである。例えば、スキーム G-4 において示すように、(G-I I b)の活性化された酸とベンゼン-1, 2-ジアミンとの反応により、中間体アミド (G-V I I I)を得、これを環化させて

、ベンズイミダゾール誘導体 (G-I X) を得る。

【0398】

スキーム G-5

【化41】



10

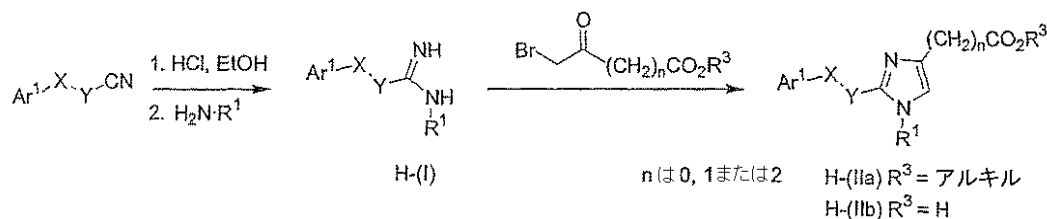
【0399】

カルボン酸 (G-I I b) を標準的還元条件下 (例えば、水素化リチウムアルミニウム) で処理して、(G-X I) を得る。(G-X I) を標準的エーテル形成条件下 (例えば、NaH、ハロ-R⁴) で処理して、(G-X I I) を得る。

【0400】

スキーム H-1

【化42】



20

【0401】

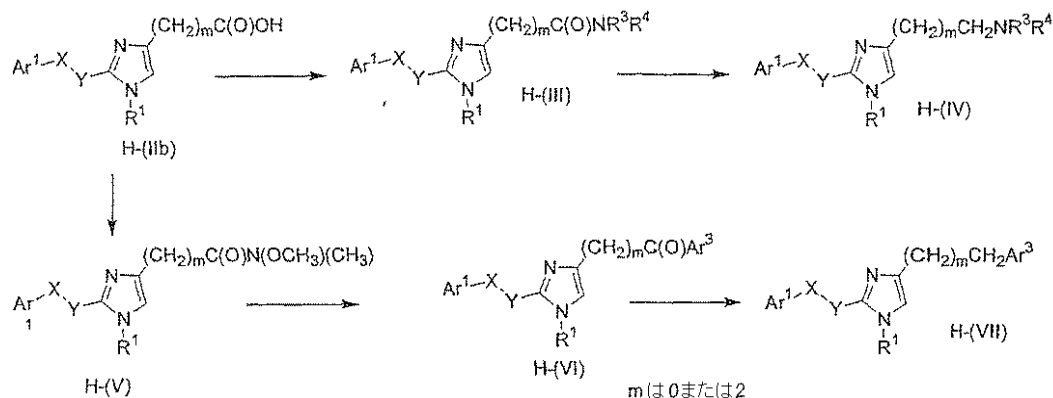
アリールニトリルをアルコールで、酸性条件下で処理して、アルコキシイミデート中間体を得、これを適当な置換アミンで、触媒条件下 (例えば、エタノール性 HCl; CuCl; Ln (I I I) イオン) で処理して、置換されたアミジン H-(I) を得る。アミジン H-(I) をプロモピルベート、または 4-プロモ-3-オキソブチレートまたは 5-プロモ-オキソペンタノエートで塩基性条件下で処理して、イミダゾールエステル H-(I I a) を得、これを加水分解して、対応する酸誘導体 H-(I I b) を得る。

30

【0402】

スキーム H-2

【化43】



40

【0403】

酸 H-(I I b) を適当に置換されたアミンと標準的カップリング手順で反応させて、所望のアミド H-(I I I) を得る。アミドを一般的還元剤、例えばジボランまたは水素化リチウムアルミニウムで還元して、対応するアミン H-(I V) を得る。別法として、

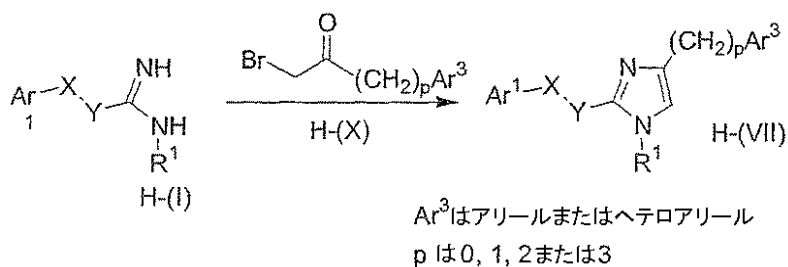
50

酸H-(IIb)をWeinrebの試薬で処理して、アミドH-(V)を得る。アミドを標準的条件下で有機金属試薬（例えば、アリールリチウムまたはアリールマグネシウムハライド）で処理して、ケトンH-(VI)を得る。ケトンを経験的な条件下で還元して、所望の生成物H-(VII)を得る。

【0404】

スキームH-3

【化44】



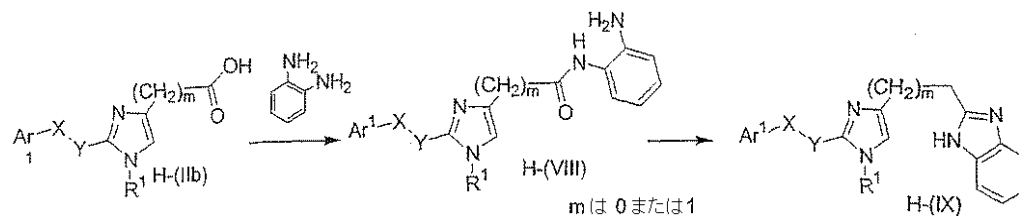
10

別法として、アミジンH-(I)のH-(X)での処理により、所望のイミダゾールH-(VII)を得る。

【0405】

スキームH-4

【化45】



20

【0406】

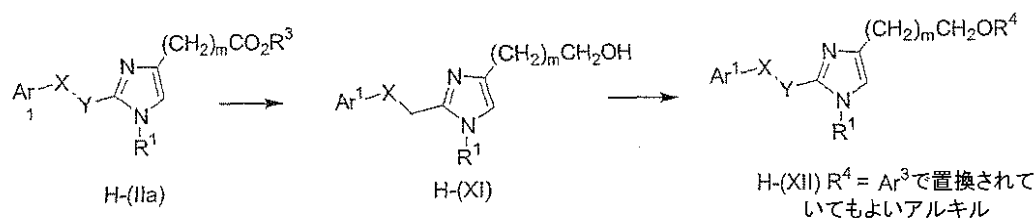
ヘテロアリール誘導体を得るための別の経路は、H-(IIb)の活性化された酸を適当な基質と反応させ、続いて環化して、所望の生成物を得ることである。例えば、スキーム4に示されるように、H-(IIb)の活性化された酸のベンゼン-1,2-ジアミンとの反応により、アミドH-(VII)を得、これを環化して、ベンズイミダゾール誘導体H-(IX)を得る。

30

【0407】

スキームH-5

【化46】



40

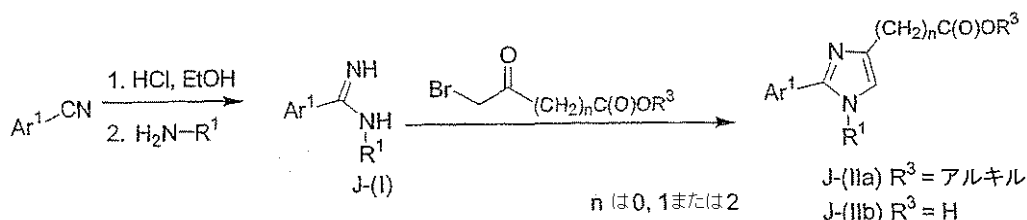
【0408】

カルボン酸(H-IIa)を標準的還元条件下(例えば、リチウム条件(例えば、 NaH 、 HAR^4))で処理して、H-(XII)を得る。

【0409】

スキームJ-1

【化 4 7】



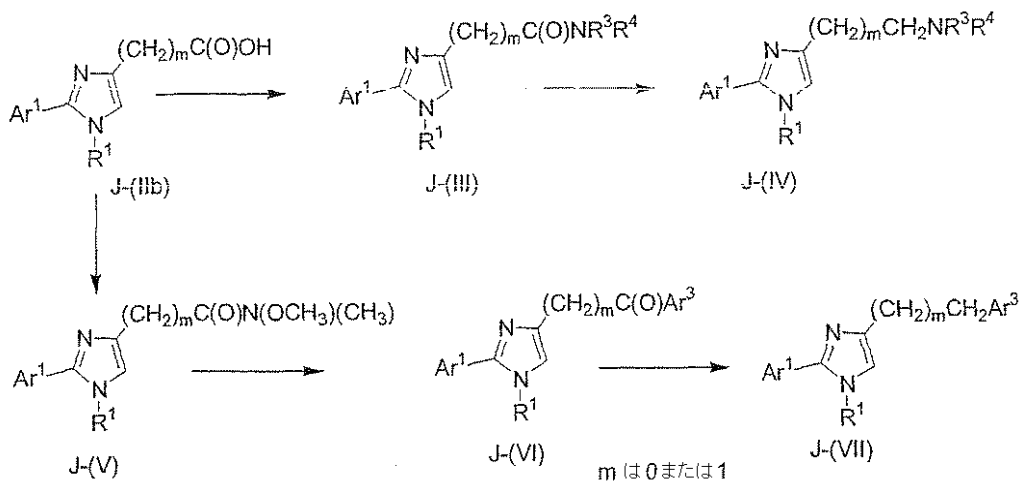
【0 4 1 0】

アリールニトリルをアルコールで、酸性条件下で処理して、アルコキシイミデート中間体を得、これを適当な置換アミンで、触媒条件下（例えば、エタノール性 HCl ; CuCl ; Ln(III) イオン）で処理して、置換されたアミジン J-(I) を得る。アミジン J-(I) をプロモピルベート、4-ブロモ-3-オキソ- β -チレート、5-ブロモ-4-オキソ-ペンタノエートまたは6-ブロモ-5-オキソ-ヘキサノエートで、塩基性条件下で処理して、対応するイミダゾールエステル J-(IIa) を得、これを加水分解して、対応する酸誘導体 J-(IIb) を得る。

【0 4 1 1】

スキーム J-2

【化 4 8】



【0 4 1 2】

酸 J-(IIb) を適当に置換されたアミンと、標準的カップリング手順で反応させて、所望のアミド J-(III) を得る。アミドを一般的還元剤、例えば、ジボランまたは水素化リチウムアルミニウムで還元して、対応するアミン J-(IV) を得る。別法として、Weinrebの試薬で酸 J-(IIb) を処理して、アミド J-(V) を得る。アミドを標準的条件下で有機金属試薬（例えば、アリールリチウムまたはアリールマグネシウムハライド）で処理して、ケトン J-(VI) を得る。ケトンを経験的な条件下で還元して、所望の生成物 J-(VII) を得る。

【0 4 1 3】

スキーム J-3

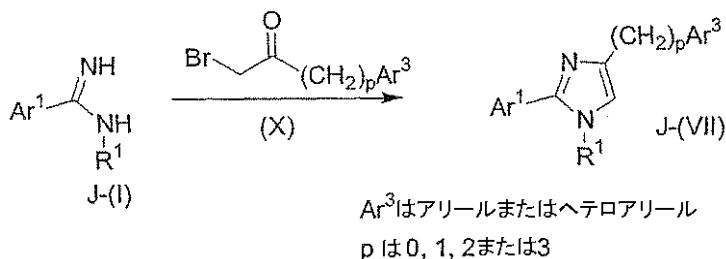
10

20

30

40

【化 4 9】

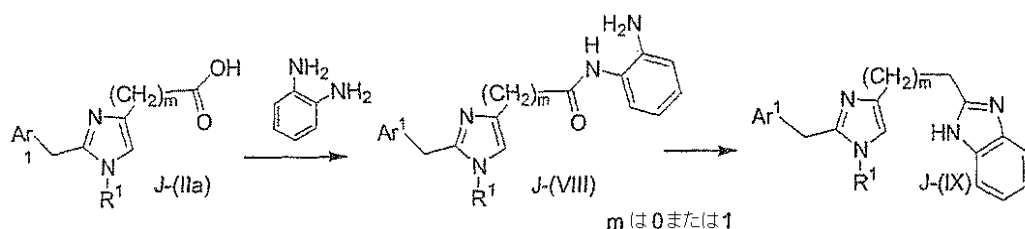


別法として、アミジン J-(I) を J-(X) で処理して、所望のイミダゾール J-(VII) を得る。 10

【0 4 1 4】

スキーム J-4

【化 5 0】



20

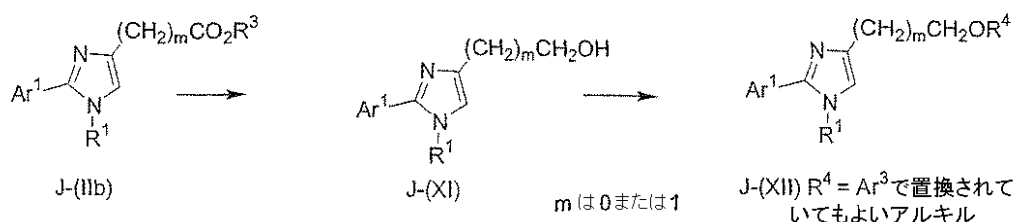
【0 4 1 5】

ヘテロアリール誘導体を得るための別の経路は、J-(IIb) の活性化された酸を適当な基質と反応させ、続いて環化して、所望の生成物を得ることである。例えば、スキーム J-4 に示すように、J-(IIb) の活性化された酸のベンゼン-1, 2-ジアミンとの反応により、中間体アミド J-(VIII) を得、これを環化させて、ベンズイミダゾール誘導体 J-(IX) を得る。

【0 4 1 6】

スキーム J-5

【化 5 1】



30

【0 4 1 7】

カルボン酸 J-(IIb) を標準的還元条件下（例えば、水素化リチウムアルミニウム）で処理して、J-(XI) を得る。J-(XI) を標準的エーテル形成条件下（例えば、NaH、ハロ-R⁴）で処理して、J-(XII) を得る。 40

【0 4 1 8】

化合物は本質的に前記および一般的スキームに記載されるようにして調製される。

本明細書において記載される、要約、記事、雑誌、刊行物、テキスト、論文、インターネットウェブサイト、データベース、特許、および特許公開物を包含するが、これに限定されない全ての参考文献は、印刷物、電子、コンピューターに読み込み可能な記憶媒体または他の形態のいずれであっても、明確に、全体として本発明の一部として参照される。

本発明を詳細な記載に関連して記載したが、前記記載事項は本発明を説明することを意図され、添付の請求の範囲により規定される本発明の範囲を制限することを意図されない。他の態様、利点、および修正は、以下の請求の範囲内に含まれる。

50

【0419】

合成された化合物は、反応混合物から分離することができ、さらに、カラムクロマトグラフィー、高圧液体クロマトグラフィー、または再結晶などの方法により精製することができる。当業者には理解できるように、本発明の式の化合物を合成するさらなる方法は、当業者には明らかであろう。さらに、様々な合成段階は、代替順序または所望の化合物を得るための順序で行うことができる。本明細書において記載される化合物の合成において有用な合成化学変化および保護基方法論（保護および脱保護）は当該分野において公知であり、例えば、R. Larock、Comprehensive Organic Transformations、第2版、Wiley-VCH Publishers（1999）；T. W. GreeneおよびP. G. M. Wuts、Protective Groups in Organic Synthesis、第3版、John Wiley and Sons（1999）；L. FieserおよびM. Fieser、Fieser and Fieser's Reagents for Organic Synthesis、John Wiley and Sons（1999）；およびL. Paquette編、Encyclopedia of Reagents for Organic Synthesis、John Wiley and Sons（1995）およびその後の版に記載されているものを包含する。

10

【0420】

本発明の化合物は、1以上の不斉中心を含有し、従って、ラセミ化合物およびラセミ混合物、1つのエナンチオマー、個々のジアステレオマーおよびジアステレオマー混合物として存在する。これらの化合物のすべてのこのような異性体形態は、明らかに本発明に含まれる。本発明の化合物は、複数の互変異性形態において表すことができ、このような場合、本発明は明らかに本明細書において記載される化合物の全ての互変異性形態を包含する（例えば、環系のアルキル化の結果、複数の部位でアルキル化が起こり、本発明は明らかにこのような反応生成物を全て包含する）。かかる化合物のこのような異性体形態はすべて明らかに本発明に含まれる。本明細書に記載される化合物のすべての結晶形態は明らかに本発明に含まれる。

20

【0421】

本明細書において用いられる場合、本明細書において記載される式の化合物を包含する本発明の化合物は、医薬的に許容される誘導体、またはそのプロドラッグを包含すると定義される。「医薬的に許容される誘導体またはプロドラッグ」なる用語は、本発明の化合物の任意の医薬的に許容される塩、エステル、エステルの塩、または他の誘導体を意味し、これは受容者に投与されると、本発明の化合物を（直接または間接的に）提供することができる。特に好ましい誘導体およびプロドラッグは、親種と比較して、かかる化合物が哺乳動物に投与された場合に、本発明の化合物のバイオアベイラビリティを増大させるか（例えば、経口投与された化合物がより容易に血中に吸収されることを許容することによる）、または親化合物の生物学的区画（例えば、脳またはリンパ系）への送達を増大させる。好ましいプロドラッグは、水性溶解度または腸膜を通る能動輸送を向上させる基が、本明細書において記載される式の構造に付与される誘導体を包含する。例えば、Alexander、J. ら、Journal of Medicinal Chemistry 1988、31、318-322；Bundgaard、H. Design of Prodrugs；Elsevier：Amsterdam、1985；pp 1-92；Bundgaard、H.；Nielsen、N. M. Journal of Medicinal Chemistry 1987、30、451-454；Bundgaard、H. A Textbook of Drug Design and Development；Harwood Academic Publ.：Switzerland、1991；pp 113-191；Digenis、G. A. ら、Handbook of Experimental Pharmacology 1975、28、86-112；Friis、G. J.；Bundgaard、H. A Textbook of Drug Design and Development

30

40

50

t; 2 ed.; Overseas Publ.: Amsterdam, 1996; pp 351-385; Pitman, I. H. Medicinal Research Reviews 1981, 1, 189-214; Sinkula, A. A.; Yalkowsky. Journal of Pharmaceutical Sciences 1975, 64, 181-210; Verbiscar, A. J.; Abod, L. G. Journal of Medicinal Chemistry 1970, 13, 1176-1179; Stella, V. J.; Himmelstein, K. J. Journal of Medicinal Chemistry 1980, 23, 1275-1282; Bodor, N.; Kaminski, J. J. Annual Reports in Medicinal Chemistry 1987, 22, 303-313 参照。 10

【0422】

本発明の化合物は、適当な官能基を付加することにより修飾して、選択的生物学的特性を向上させることができる。このような修飾は、当該分野において公知であり、所定の生物学的区画（例えば、血液、リンパ系、神経系）中への生物学的透過を増大させ、経口利用可能性を増大させ、注射による投与を可能にするために溶解度を増大させ、代謝を変更し、放出速度を変更するものを包含する。

【0423】

本発明の化合物の医薬的に許容される塩は、医薬的に許容される無機および有機酸および塩基から誘導されるものを包含する。好適な酸塩の例としては、酢酸塩、アジピン酸塩 20、アルギン酸塩、アスパラギン酸塩、安息香酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、重硫酸塩、酪酸塩、クエン酸塩、樟脳酸塩、カンファースルホン酸塩、ジグルコン酸塩、ドデシル硫酸塩、エタンスルホン酸塩、ギ酸塩、フマル酸塩、グルコヘプタン酸塩、グリコール酸塩、ヘミ硫酸塩、ヘプタン酸塩、ヘキサン酸塩、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、2-ヒドロキシエタンスルホン酸塩、乳酸塩、マレイン酸塩、マロン酸塩、メタンスルホン酸塩、2-ナフタレンスルホン酸塩、ニコチン酸塩、硝酸塩、パモ酸塩、ペクチン酸塩、過硫酸塩、3-フェニルプロピオン酸塩、リン酸塩、ピクリン酸塩、ピバル酸塩、プロピオン酸塩、サリチル酸塩、コハク酸塩、硫酸塩、酒石酸塩、チオシアン酸塩、トシル酸塩、およびウンデカン酸塩が挙げられる。他の酸、例えば、シュウ酸は、それ自体は医薬的に許容されないが、本発明の化合物およびその医薬的に許容される酸付加塩を得る際の中 30間体として有用な塩の調製において用いることができる。適当な塩基から誘導される塩としては、アルカリ金属（例えば、ナトリウム）、アルカリ土類金属（例えば、マグネシウム）、アンモニウムおよびN-（アルキル）₄⁺塩が挙げられる。本発明はさらに、本明細書に開示されている化合物の任意の塩基性窒素含有基の四級化を含む。水または油溶性、または分散性生成物は、かかる四級化により得ることができる。

【0424】

本明細書において記載される式の化合物は、例えば、注射、静脈内、動脈内、表皮下、腹腔内、筋肉内、または皮下に；あるいは経口、口腔内、経鼻、経粘膜、局所、点眼薬、または吸入により、体重1kgあたり約0.5～約100mg、あるいは各投与あたり 401mgから1000mgの間の用量で、4～120時間ごとに、または特定の医薬の要件に従って投与することができる。本明細書において記載される方法は、所望の、または所定の効果を達成するための、有効量の化合物、または化合物組成物の投与を意図する。典型的には、本発明の医薬組成物は、1日あたり約1～約6回、または連続注入として投与される。かかる投与は、慢性または急性療法として用いることができる。担体物質と組み合わせる1回量にすることができる活性成分の量は、治療される宿主および特定の投与様式によって変わるであろう。典型的な製剤は、約5%～約95%の活性化合物（w/w）を含有する。あるいは、かかる製剤は、約20%～約80%の活性化合物を含有する。

【0425】

前記よりも少ないかまたは多い用量が必要とされ得る。任意の特定の対象者についての特定の投与量および治療計画は、使用される特定の化合物の活性、年齢、体重、全体的な 50

健康状態、性別、食事、投与回数、放出速度、医薬の組み合わせ、疾患、状態または症状の重篤度および経過、患者の疾患、状態または症状に対する傾向、および治療する医師の判断をはじめとする様々な因子に依存する。

患者の状態が改善されると、維持量の本発明の化合物、組成物または組み合わせを必要に応じて投与することができる。その後、用量または投与の頻度、または両方を、症状の関数として、症状が所望のレベルに軽減された場合に改善された状態が持続されるレベルに減少させ、治療を中止すべきである。しかしながら、患者は、病徴の再発に基づいて長期に断続的治療を必要とする場合がある。

【0426】

本明細書において示される組成物は、本明細書において示される式の化合物、ならびにもし存在するならば追加の治療薬を、イオンチャンネルが介在する障害、またはその症状を包含する疾患または病徴の調節を達成するために有効な量で含む。追加の治療薬の例を含む参考文献は次のものである：1) Burger's Medicinal Chemistry & Drug Discovery 第6版、Alfred Burger、Donald J. Abraham編、第1～6巻、Wiley Interscience Publication、NY、2003；2) Ion Channels and Disease Francis M. 著 Ashcroft、Academic Press、NY、2000；および3) Calcium Antagonists in Clinical Medicine 第3版、Murray Epstein、MD、FACP編、Hanley & Belfus、Inc.、Philadelphia、PA、2002。追加の治療薬は、これらに限定されないが、心血管疾患（例えば、高血圧、狭心症、心房性細動、卒中の予防、心不全、急性心筋虚血など）、代謝性疾患（例えば、X症候群、糖尿病、肥満）、腎臓または尿生殖器疾患（例えば、糸球体腎炎、尿失禁、ネフローゼ症候群）、およびその病徴の治療用医薬を包含する。心血管疾患および病徴の追加の治療薬の例は、これらに限定されないが、抗高血圧剤、ACE抑制剤、アンギオテンシンIIレセプター拮抗物質、スタチン、 β 遮断薬、酸化防止剤、抗炎症薬、抗血栓薬、抗凝固剤、または抗不整脈剤を包含する。代謝性疾患および病徴を治療するための追加の治療薬の例は、ACE抑制剤、アンギオテンシンII拮抗物質、フィブレート、チアゾリジンジオンまたはスルホニル尿素抗糖尿病薬を包含するが、これに限定されない。腎臓および／または尿生殖器症候群およびその症状を治療するための追加の治療薬の例は、これらに限定されないが、アルファ-1アドレナリン作用性拮抗物質（例えば、ドキサゾシン）、抗ムスカリン作用薬（例えば、トルテロジン）、ノルエピネフリン／セロトニン再摂取阻害剤（例えば、デュロキセチン）、三環系抗鬱薬（例えば、ドキシペミン、デシプラミン）、またはステロイドを包含する。

【0427】

「医薬的に許容される担体またはアジュバント」なる用語は、患者に本発明の化合物とともに投与することができ、治療量の化合物を送達するために十分な量で投与された場合に、その薬理活性を損なわず、非毒性である担体またはアジュバントを意味する。

【0428】

本発明の医薬組成物において用いることができる医薬的に許容される担体、アジュバントおよびビヒクルは、これらに限定されないが、イオン交換体、アルミナ、ステアリン酸アルミニウム、レシチン、自己乳化性薬物送達系（SEDDS）、例えば、d- α -トコフェロールポリエチレングリコール1000コハク酸塩、医薬形態において用いられる界面活性剤、例えば、Tweensまたは他の類似のポリマー送達マトリックス、血清タンパク質、例えばヒト血清アルブミン、緩衝物質、例えば、リン酸塩、グリシン、ソルビン酸、ソルビン酸カリウム、飽和植物性脂肪酸の部分グリセリド混合物、水、塩または電解質、例えば、硫酸プロタミン、リン酸水素二ナトリウム、リン酸水素カリウム、塩化ナトリウム、亜鉛塩、コロイド状シリカ、マグネシウムトリシリケート、ポリビニルピロリドン、セルロース系物質、ポリエチレングリコール、カルボキシメチルセルロースナトリウム、ポリアクリレート、ワックス、ポリエチレンーポリオキシプロピレンーブロックポリ

マー、ポリエチレングリコールおよび羊毛脂を包含する。シクロデキストリン、例えば、 α 、 β 、および γ -シクロデキストリン、またはその化学的に修飾された誘導体、例えば、2-および3-ヒドロキシプロピル- β -シクロデキストリン、または他の可溶化誘導体をはじめとするヒドロキシアルキルシクロデキストリンも、本明細書において記載される式の化合物の送達を向上させるために有利に用いることができる。

【0429】

本発明の医薬組成物は、経口、非経口、吸入スプレー、局所、直腸、鼻、頬、膺または埋込貯蔵器により、好ましくは経口投与、または注射による投与により投与することができる。本発明の医薬組成物は、通常、非毒性の医薬的に許容される担体、アジュバントまたはビヒクルを含有することができる。場合によっては、処方された化合物またはその送達形態の安定性を向上させるために、処方のpHは医薬的に許容される酸、塩基または緩衝剤で調節することができる。本明細書において用いられる非経口なる用語は、皮下、皮内、静脈内、筋肉内、関節内、動脈内、滑液内、胸骨内、鞘内、病変内および頭蓋内注射、または注入技術を包含する。

10

【0430】

医薬組成物は、例えば、無菌注射用水性または油性懸濁液としてなどの滅菌注射可能な製剤の形態であってよい。この懸濁液は、当該分野において公知の技術に従って、好適な分散または湿潤剤（例えば、Tween 80）および懸濁化剤を用いて処方することができる。無菌注射用製剤は、非毒性の非経口的に許容される希釈剤または溶媒中の無菌注射用溶液または懸濁液、例えば、1, 3-ブタンジオール中溶液であってもよい。使用できる許容されるビヒクルおよび溶媒のうち、マンニトール、水、リンガー液および等張性塩化ナトリウム溶液が溶媒または懸濁媒体として通常用いられる。この目的のために、合成モノ-またはジグリセリドをはじめとする任意の刺激のない固定油を用いることができる。脂肪酸、例えば、オレイン酸およびそのグリセリド誘導体、例えば、天然の医薬的に許容される油、例えば、オリーブ油またはヒマシ油、特にそのポリオキシエチル化物が、注射物の調製において有用である。これらの油溶液または懸濁液は、長鎖アルコール希釈剤または分散剤、またはカルボキシメチルセルロース、または医薬的に許容される投与形態、例えば、エマルジョンおよび懸濁剤の処方において一般的に用いられる類似の分散剤も含有することができる。他の一般的に用いられる界面活性剤、例えば、TweensまたはSpansおよび／または医薬的に許容される固体、液体、または他の投与形態の製造において通常用いられる他の類似の乳化剤またはバイオアベイラビリティ向上剤も、処方の目的で使用するすることができる。

20

30

【0431】

本発明の医薬組成物は、これらに限定されないが、カプセル、錠剤、エマルジョンおよび水性懸濁液、分散液および溶液をはじめとする任意の経口的に許容される投与形態において、経口投与することができる。経口使用のための錠剤の場合、通常用いられる担体は、ラクトースおよびコーンスターチを包含する。潤滑剤、例えば、ステアリン酸マグネシウムも典型的に添加される。カプセル形態における経口投与に関して、有用な希釈剤は、ラクトースおよび乾燥コーンスターチを包含する。水性懸濁液および／またはエマルジョンが経口投与される場合、活性成分は、油性相中に懸濁または溶解させることができ、乳化剤および／または懸濁化剤と組み合わせられる。所望により、ある種の甘味料および／または矯味矯臭剤および／または着色剤を添加することができる。

40

【0432】

本発明の医薬組成物は、直腸投与のための坐剤の形態においても投与できる。これらの組成物は、本発明の化合物を、室温で固体であるが、直腸温度で液体であり、従って直腸中で溶融して、活性成分を放出する、適当な非刺激性賦形剤と混合することにより調製することができる。かかる物質としては、これらに限定されないが、カカオ脂、ミツロウおよびポリエチレングリコールが挙げられる。

【0433】

本発明の医薬組成物の局所投与は、所望の治療が、局所投与により容易に接近可能な部

50

分または器官を含む場合に有用である。皮膚への局所投与に関して、医薬組成物は、担体中に懸濁または溶解された活性成分を含有する適当な軟膏で処方すべきである。本発明の化合物の局所投与用担体は、これらに限定されないが、鉱油、液体石油、白石油、ポリエチレングリコール、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレン化合物、乳化ワックスおよび水を包含する。あるいは、医薬組成物は、適当な乳化剤と共に担体中に懸濁または溶解された活性化合物を含有する適当なローションまたはクリームで処方することができる。適当な担体としては、これらに限定されないが、鉱油、ソルビタンモノステアレート、ポリソルベート60、セチルエステルワックス、セテアリアルアルコール、2-オクチルデカノール、ベンジルアルコールおよび水が挙げられる。本発明の医薬組成物は、直腸坐剤処方によるかまたは適当な浣腸剤で下部腸管に局所投与することもできる。局所一経皮貼付剤も本発明に含まれる。 10

【0434】

本発明の医薬組成物は、鼻エアゾルまたは吸入により投与することができる。かかる組成物は、医薬処方の分野において周知の技術に従って調製され、ベンジルアルコール又は他の適当な保存料、バイオアベイラビリティを向上させるための吸収促進剤、フルオロカーボン、および／または当該分野において公知の他の可溶化剤または分散剤を用いて、食塩水中溶液として調製することができる。

【0435】

本発明の式の化合物および追加の医薬（例えば、治療薬）を有する組成物は、埋込可能な装置を用いて投与することができる。埋込可能な装置および関連する技術は当該分野において公知であり、本明細書において示される化合物または組成物の連続、または時限放出性送達有望な送達系として有用である。さらに、埋込可能な装置送達系は、化合物または組成物送達の特定点（例えば、局所部位、器官）のターゲティングに有用である。Negrinら、Biomaterials、22(6):563 (2001)。交互送達法を含む時限放出性技術も本発明において用いることができる。例えば、ポリマー技術に基づく時限放出性処方、持続放出技術およびカプセル封入技術（例えば、ポリマー、リポソーム）も、本明細書において示される化合物および組成物の送達に有用である。 20

【0436】

本発明の活性化学療法組成物を送達するための貼付剤も本発明の範囲内に含まれる。貼付剤は、物質層（例えば、ポリマー、布、ガーゼ、包帯）および本明細書において示される式の化合物を含む。物質層の片面は、化合物または組成物の通過に抵抗するための、これに接着された保護層を有し得る。貼付剤はさらに、対象上の位置に貼付剤を保持するための接着剤を含む。接着剤は、天然または合成起源のいずれかのものであって、対象の皮膚と接触した場合、一時的に皮膚に接着するものを包含する組成物である。これは耐水性であり得る。接着剤は、貼付剤上に配置され、これを長時間、対象の皮膚と接触した状態に保持することができる。接着剤は、装置を対象が偶発的に接触しても所定の位置に装置を保持するが、積極的行動（例えば、引き裂いたり、剥がしたり、または他の故意に除去すること）により、装置または接着剤自体に加えられた外部圧力により接着性を失い、接着しなくなるような粘着性、または接着強度を有するように調製することができる。接着剤は、感圧性であり得る。すなわち、接着剤または装置上に圧力を加えること（例えば、押したり、こすったり）により、皮膚に対して接着剤を配置する（そして、装置を皮膚に接着させる）ことが可能である。 30 40

【0437】

本発明の組成物が、本明細書における式の化合物および1以上の追加の治療薬または予防薬の組み合わせを含む場合、化合物および追加の医薬はどちらも、単剤療法において通常投与される用量の約1~100%の間、さらに好ましくは約5~95%の投与量で存在する。追加の医薬は、本発明の化合物とは別に、複数投与計画の一部として、投与することができる。別法として、これらの医薬は、単一投与形態の一部として、単一組成物中、本発明の化合物と混合することができる。

【0438】

本発明を以下の実施例においてさらに説明する。これらの実施例は例示の目的のみであって、本発明をなんら制限するものではない。

実施例 A 1

【0439】

卵母細胞検定

本明細書における式の代表的化合物を、本質的に、Neuron January 1997、18(11):153-166、Linら、; J. Neurosci. July 1、2000、20(13):4768-75、J. PanおよびD. Lipscombe; およびJ. Neurosci.、August 15、2001、21(16):5944-5951、W. XuおよびD. Lipscombeにおいて記載されるような検定において、Xenopus oocyte異種発現系を用いて、カルシウムチャンネルターゲットに対する活性についてスクリーンする。検定は、様々なカルシウムチャンネル(例えば、Ca_v1.2またはCa_v1.3サブファミリー)に関して行い、これにより、各化合物についてカルシウムチャンネルの調節を測定する。

10

実施例 A 2

【0440】

HEKアッセイ

HEK-293T/17細胞を、FuGENE 6 Package Insert Version 7、April 2002、Roche Applied Science、Indianapolis、INにおいて記載されているのと同様にして、一時的にトランスフェクトさせる。細胞を、インキュベーターにおいて、6穴プレート中、2 mL中 2.5×10^5 細胞で、一夜プレートし、30~40%のコンフルエンスを達成する。無菌細管中に、合計体積100 μ Lにするために十分な無血清培地をFuGENEトランスフェクション試薬(Roche Applied Science、Indianapolis、IN)の希釈剤として添加する。3 μ LのFuGENE 6試薬を直接この培地中に添加する。混合物を静かにたたいて混合する。2 μ gのDNA溶液(0.8~2.0 μ g/ μ L)をあらかじめ希釈された前記のFuGENE 6試薬に添加する。DNA/FuGENE 6混合物を静かにピペットで吸引して内容物を混合し、約15分間、室温でインキュベートする。複合体混合物を次にHEK-293T/17細胞に添加し、これを穴の周りに分布させ、かき混ぜて確実に均一に分散させる。細胞をインキュベーターに24時間戻す。トランスフェクトされた細胞を次に 2.5×10^5 の密度で、5のガラス製カバースリップを有する35 mm皿中に再度プレートし、低血清(1%)培地中で24時間成長させる。カバースリップを細胞から取り除き、次にチャンバー中に移し、カウンタスクリーニングのためにカルシウムチャンネル(例えば、Lタイプ、Nタイプなど)流れまたは他の流れを一時的にトランスフェクトされたHEK-293T/17細胞から記録する。

20

30

【0441】

本質的にThompsonおよびWong(1991)J. Physiol.、439:671-689より記載されているようにして、電圧依存性流を評価するために、パッチクランプ技術の全細胞電圧クランプ配置を用いる。化合物の抑制効力(定常状態濃度-応答分析)を評価するためにカルシウムチャンネル(例えば、Lタイプ、Nタイプなど)流を記録するために、5パルスの約+10 mV(電流電圧関係のピーク)までの20~30 ms電圧段階を、-100 mVの保持電位から30秒ごとに5 Hzで供給する。化合物の評価は、本質的にSah DWおよびBean BP(1994)Mol Pharmacol. 45(1):84-92により記載されているようにして行う。

40

実施例 A 3

【0442】

ホルマリン試験

本明細書における式の代表的化合物をホルマリン試験において活性についてスクリーンする。ホルマリン試験は、急性および持続性炎症性疼痛のモデルとして広く用いられてい

50

る (Dubuissou & Dennis, 1977 Pain 4:161-174; Wheeler-Acetoら, 1990, Pain 40:229-238; Coderreら, 1993, Pain 52:259-285)。この試験は、ラット後足に希ホルマリン溶液を投与し、続いて、末梢神経活性および中枢性感作の両方を反映するホルマリン応答の「後期 (late phase)」(注射後11~60分)の間、行動の徴候(すなわち、縮みあがったり、かみついたり、なめたりする)をモニターすることを含む。体重約225~300gのオスSprague-Dawleyラット(Harlan, Indianapolis, IN)を、各処置群についてn=6~8で使用する。

【0443】

薬物動力学的特性および投与経路によって、ビヒクルまたは試験化合物を、腹腔内または経口経路により各ラットにホルマリンの前30~120分に投与する。ホルマリン投与の60分前に各動物を実験室に順化させ、50μLの5%溶液を、300μLマイクロシリンジおよび29ゲージ針を用いて、後足の足底表面中に注射する。動物の足の観察を高めるために、鏡を実験室の後ろ側に向ける。縮あがる回数(素速く足を震わせながら、または震わせずに足を持ち上げる)および傷つけられた後足にかみつく、および/または舐めるために費やす時間を、各ラットについて連続して2分間、5分毎に、ホルマリン投与後、合計60分間記録する。終末部血液サンプルを、血漿化合物の濃度の分析のために採取する。早期または後期の間の縮む合計回数またはかみつきおよび/または舐めるのに費やす時間のグループ間の比較を、一元配置分散分析(ANOVA)を用いて行う。P<0.05は統計的に有意と見なされ、p=0.05~1.0は統計的傾向の証拠と見なした。データは、60分の実験観察期間の間、各5分間隔で、平均±S.E.M.としてグラフにより表した。化合物は、ホルマリン応答の後期の間の収縮の回数またはかみつきおよび/またはなめに費やす時間を抑制する能力に基づいて有効と見なされた。

本明細書における式の代表的化合物を、カルシウムチャンネルターゲットに対する活性について評価した。

実施例 A 4

【0444】

方法 A

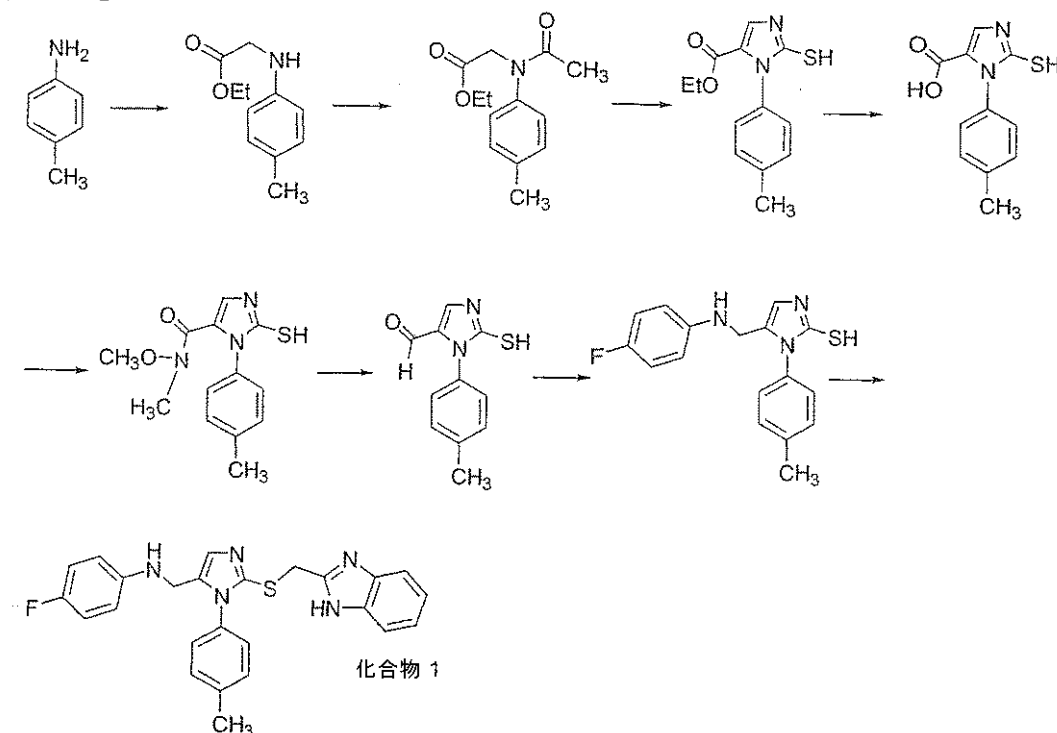
化合物 A 1 (スキーム A 5 の化合物 1)

{2-[2-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-エチルスルファニル]-3-p-トリル-3H-イミダゾール-4-イルメチル}-(4-フルオロフェニル)-アミン

【0445】

スキーム A 5

【化 5 2】



10

20

【0 4 4 6】

パート 1 p-トリルアミノ-酢酸エチルエステルの調製

p-トリルイジン (16.6 g、155ミリモル)、酢酸ナトリウム (16.5 g、201.5ミリモル) のエタノール (200 mL) 中混合物を攪拌し、ブromo酢酸エチル (16.5 mL、155ミリモル) を室温で添加した。混合物を 80℃ で 1 時間加熱し、次いで室温に冷却した。混合物を水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮した。得られた残留物をクロマトグラフィー (SiO₂、20% n-ヘキサン中酢酸エチル) により精製して、白色固体として、p-トリルアミノ-酢酸エチルエステル (23.9 g、124ミリモル) を得た。

30

【0 4 4 7】

パート 2 (アセチル-p-トリル-アミノ)-酢酸エチルエステルの調製

p-トリルアミノ-酢酸エチルエステル (23.9 g、124ミリモル) の THF (300 mL) 中冷却溶液を攪拌し、塩化アセチル (10.5 mL、148ミリモル) をゆっくりと添加した。混合物を 1 時間攪拌し、水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、白色固体として、(アセチル-p-トリル-アミノ)-酢酸エチルエステル (14.3 g、96ミリモル) を得た。

【0 4 4 8】

パート 3 2-メルカプト-3-p-トリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステルの調製

p-トリルアミノ-酢酸エチルエステル (5.0 g、21.3) およびギ酸エチル (5.3 g、71.3ミリモル) のベンゼン (10 mL) 中溶液を 0℃ に冷却し、カリウムエトキシド (21.3ミリモル) を添加した。混合物を冷蔵庫中に入れて一夜静置し、水で抽出した。水性溶液に、チオシアン酸カリウム (2.14 g、22.0ミリモル) および濃水性 HCl (4 mL) を添加した。混合物を 2 時間 60℃ で加熱し、次いで冷却した。混合物を酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、白色固体として 2-メルカプト-3-p-トリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル (1.7 g、6.5ミリモル) を得た。

40

【0 4 4 9】

パート 4 2-メルカプト-3-p-トリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸の

50

調製

2-メルカプト-3-パートリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル (1.2 g、4.6 ミリモル) の 1, 4-ジオキサン (10 mL) 中溶液を攪拌し、水酸化リチウム水和物 (1 M、10 mL) を添加し、混合物を室温で 2 時間攪拌した。混合物を水性 2 N HCl で中和し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、白色固体として、2-メルカプト-3-パートリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸 (1 g、4.3 ミリモル) を得た。

【0450】

パート 5 2-メルカプト-3-パートリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸メトキシ-メチル-アミドの調製

2-メルカプト-3-パートリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸 (0.468 g、2 ミリモル)、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド塩酸塩 (0.382 g、2 ミリモル) および N, O-ジメチルヒドロキシルアミン (0.195 g、2 ミリモル) のピリジン (4 mL) 中混合物を 40 °C で一夜加熱した。混合物を冷却し、水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、油状物として、2-メルカプト-3-パートリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸メトキシ-メチル-アミド (0.245 g、0.88 ミリモル) を得た。

【0451】

パート 6 2-メルカプト-3-パートリル-3H-イミダゾール-4-カルボアルデヒドの調製

水素化リチウムアルミニウム (0.10 g、2.65 ミリモル) のテトラヒドロフラン (10 mL) 中混合物を窒素ブランケット下、0 °C で攪拌し、THF (5 mL) 中 2-メルカプト-3-パートリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸メトキシ-メチル-アミド (0.245 g、0.88 ミリモル) を添加した。混合物を室温に温め、2 時間攪拌した。混合物を 0 °C に冷却し、水性 15 % 重炭酸ナトリウムおよび水で急冷し、次いで、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、固体として、2-メルカプト-3-パートリル-3H-イミダゾール-4-カルボアルデヒド (0.176 g、0.80 ミリモル) を得た。

【0452】

パート 7 2-メルカプト-3-パートリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸 (4-フルオロフェニル)-アミドの調製

2-メルカプト-3-パートリル-3H-イミダゾール-4-カルボアルデヒド (0.176 g、0.80 ミリモル) および 4-フルオロアニリン (0.80 ミリモル、8.8 mmol) の DMF/酢酸 (10/1 : v/v、3 mL) 中溶液を、室温で 1 時間攪拌した。ナトリウムシアノボロヒドリド (0.76 g、1.2 ミリモル) を添加し、混合物を一夜攪拌した。混合物を水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、濃縮して、残留物を得た。クロマトグラフィー (SiO₂、5 % 塩化メチレン中メタノール) により精製して、固体として、2-メルカプト-3-パートリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸 (4-フルオロフェニル)-アミド (0.05 g、0.16 ミリモル) を得た。

【0453】

パート 8 2-[2-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-エチルスルファニル]-3-パートリル-3H-イミダゾール-4-イルメチル-(4-フルオロフェニル)-アミンの調製

2-メルカプト-3-パートリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸 (4-フルオロフェニル)-アミド (0.05 g、0.16 ミリモル) および 2-(クロロメチル)ベンズイミダゾール (0.032 g、0.19 ミリモル) のアセトン (5 mL) 中混合物を攪拌し、炭酸カリウム (0.048 g、0.35 ミリモル) を添加した。混合物を 40 °C で 2 時間加熱し、冷却した。混合物を水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、固体を得た。この固体をジエチルエーテル中に溶解させ、エーテル性 HCl の溶液を添加した。混合物を真空下で濃縮して、HCl 塩として 2-[2-

10

20

30

40

50

(1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-エチルスルファニル]-3-p-トリル-3H-イミダゾール-4-イルメチル}- (4-フルオロフェニル)-アミン (0.042 g、0.08ミリモル) を得た。

【0454】

方法 B

化合物 2 (スキーム A 2 の化合物 2)

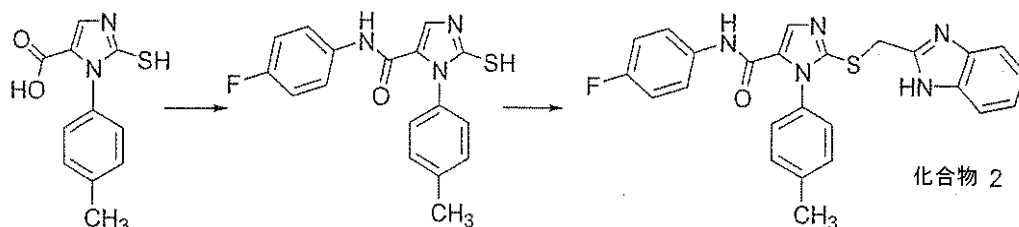
2-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチルスルファニル)-3-p-トリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸 (4-フルオロフェニル)-アミド

【0455】

スキーム A 2

10

【化 5 3】



パート 1 2-メルカプト-3-p-トリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸 (4-フルオロフェニル)-アミドの調製 20

2-メルカプト-3-p-トリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸 (0.468 g、2ミリモル)、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド塩酸塩 (0.382 g、2ミリモル) および 4-フルオロアニリン (0.222 g、2ミリモル) のピリジン (4 mL) 中混合物を 40℃ で一夜加熱した。混合物を冷却し、水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、油状物として、2-メルカプト-3-p-トリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸 (4-フルオロフェニル)-アミド (0.206 g、0.63ミリモル) を得た。

【0456】

パート 2 2-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチルスルファニル)-3-p-トリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸 (4-フルオロフェニル)-アミドの調製 30

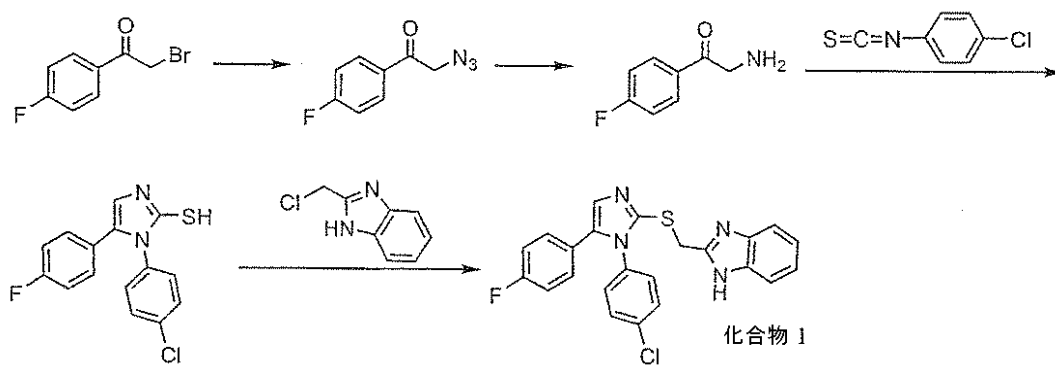
2-メルカプト-3-p-トリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸 (4-フルオロフェニル)-アミド (0.206 g、0.63ミリモル) および 2-(クロロメチル)ベンゾイミダゾール (0.166 g、1.00ミリモル) のアセトン (10 mL) 中溶液を攪拌し、炭酸カリウム (0.191 g、1.12ミリモル) を添加した。混合物を 40℃ で 2 時間加熱し、冷却した。混合物を水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、固体を得た。クロマトグラフィー (SiO₂、20% n-ヘキサン中アセトン) により精製して、白色固体として、2-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチルスルファニル)-3-p-トリル-3H-イミダゾール-4-カルボン酸 (4-フルオロフェニル)-アミド (0.133 g、0.29ミリモル) を得た。 40

実施例 B 4

【0457】

スキーム B 2

【化 5 4】



10

化合物 1 (スキーム B 2 の化合物 1)

2-[1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1H-イミダゾール-2-イルスルファニルメチル]-1H-ベンゾイミダゾール

パート 1 2-アジド-1-(4-フルオロフェニル)-エタノンの調製

2-ブロモ-1-(4-フルオロフェニル)-エタノン (2.5 g、11.5 ミリモルの DMSO (15 mL) 中溶液を 10℃ で激しく攪拌し、アジ化ナトリウム (0.94 g、14.4 ミリモル) を添加した。混合物を 1 時間攪拌し、次いで水 (20 mL) で急冷し、酢酸エチルで抽出した (2 x 25 mL)。合した有機層を水 (25 mL) および食塩水 (25 mL) で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮して、粘稠性黄赤色液体として、2-アジド-1-(4-フルオロフェニル)-エタノン (1.7 g、9.3 ミリモル) を得た。

20

【0458】

パート 2 2-アミノ-1-(4-フルオロフェニル)-エタノン塩酸塩の調製

2-アジド-1-(4-フルオロフェニル)-エタノン (8.0 g、44.7 ミリモルのエタノール (125 mL) 中溶液に、濃縮水性 HCl (6 mL) および 10% Pd/C (10 モル%) を添加した。混合物を水素 (H₂) 雰囲気下、45 psi で 1 時間攪拌した。セライトを通して混合物を濾過し、セライトケーキを大量のメタノールで洗浄した。溶媒を減圧下で、半固体をジエチルエーテルで磨砕し、濾過し、乾燥して、白色結晶性固体として、2-アミノ-1-(4-フルオロフェニル)-エタノン塩酸塩 (5.0 g、26.5 ミリモル) を得た。

30

【0459】

パート 3 1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1H-イミダゾール-2-チオールの調製

2-アミノ-1-(4-フルオロフェニル)-エタノン塩酸塩 (5.0 g、26.5 ミリモル)、4-クロロフェニルイソチオシアネート (4.49 g、26.5 ミリモル) および炭酸水素ナトリウム (3.3 g、39.7 ミリモル) のエタノール (100 mL) 中混合物を 90℃ で 2 時間加熱した。溶媒を減圧下で除去した。得られた残留物を水性 1 N 水酸化ナトリウム (50 mL) 中に再懸濁させ、100℃ で一夜加熱した。熱混合物を濾過し、冷却し、水性 6 N HCl で慎重に酸性化した。得られた混合物を濾過して、乾燥後に黄色固体として、1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1H-イミダゾール-2-チオール (8.0 g、26.3 ミリモル) を得た。

40

【0460】

パート 4 2-[1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1H-イミダゾール-2-イルスルファニルメチル]-1H-ベンゾイミダゾールの調製

1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1H-イミダゾール-2-チオール (4.0 g、13.2 ミリモル)、2-(クロロメチル)ベンゾイミダゾール (2.2 g、13.2 ミリモル) および炭酸カリウム (5.5 g、39.6 ミリモ

50

ル)のアセトン(50 mL)中混合物を、全ての出発物質が消費されるまで、75℃で加熱した。混合物を冷却し、溶媒を減圧下で除去した。得られた残留物を1:1:1水/酢酸エチル/ヘキサン中で分配した。褐色固体を濾過し、乾燥し、最小量のメタノール中に再懸濁させた。メタノール混合物を濾過し、乾燥して、白色固体を得た。固体をメタノール中に再懸濁させ、エーテル性2N HClで、溶液が存続するまで処理した。溶液を大量のジエチルエーテルで希釈して、沈殿を促進し、濾過し、乾燥して、白色固体として2-[1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1H-イミダゾール-2-イルスルファニルメチル]-1H-ベンゾイミダゾール(3.5 g、7.4ミリモル)を得た。

実施例 C 4

10

【0461】

方法 C A

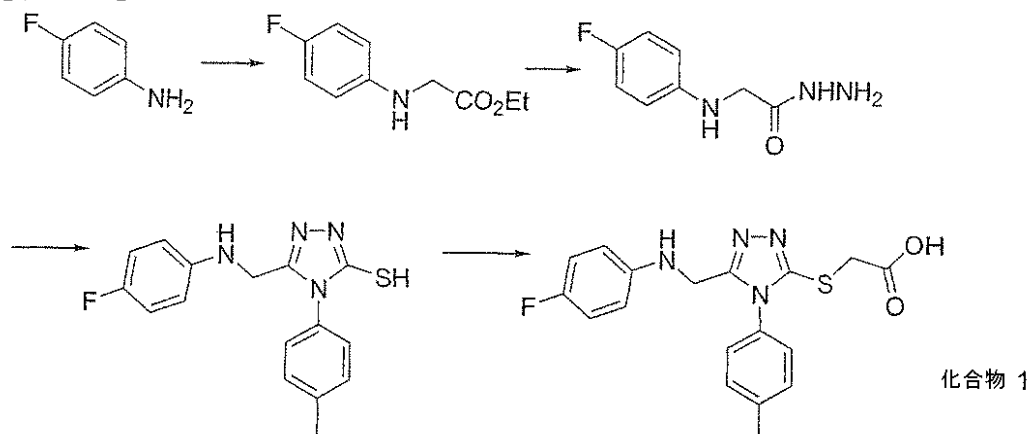
化合物 C 1 (スキーム C 4 の化合物 1)

{5-[(4-フルオロフェニルアミノ) -メチル] -4-p-トリル-4H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニル} -酢酸

【0462】

スキーム C 4

【化 5 5】



20

30

パート 1 (4-フルオロフェニルアミノ) -酢酸エチルエステルの調製

4-フルオロアニリン(10 g、90ミリモル)、ブromo酢酸塩(15 g、90ミリモル)、および酢酸ナトリウム(11 g、135ミリモル)のエタノール(200 mL)中混合物を2時間還流加熱した。反応を冷却し、真空下で濃縮した。残留物を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、白色固体として(4-フルオロフェニルアミノ) -酢酸エチルエステル(8.46 g、42.9ミリモル)を得た。

【0463】

パート 2 (4-フルオロフェニルアミノ) -酢酸ヒドラジドの調製

40

(4-フルオロフェニルアミノ) -酢酸エチルエステルおよびヒドラジン(8.23 g、257ミリモル)のエタノール(200 mL)中混合物を3時間還流させた。反応を冷却し、真空下で濃縮した。残留物をn-ヘキサン(75 mL)で磨砕して、白色固体として、(4-フルオロフェニルアミノ) -酢酸ヒドラジド(5.5 g、30.20ミリモル)を得た。

【0464】

パート 3 5-[(4-フルオロフェニルアミノ) -メチル] -4-p-トリル-2, 4-ジヒドロ-[1, 2, 4] トリアゾール-3-チオンの調製

(4-フルオロフェニルアミノ) -酢酸ヒドラジドおよびp-トルエンイソチオシアネート(4.5 g、30.20ミリモル)の水性2N水酸化ナトリウム(100 mL)中混

50

合物を数時間加熱し、次いで冷却した。溶液を6 N塩酸で中和し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、褐色残留物を得た。残留物をn-ヘキサン(100 mL)で磨砕して、白色固体として、5-[(4-フルオロフェニルアミノ) -メチル] -4-p-トリル-2, 4-ジヒドロ-[1, 2, 4] トリアゾール-3-チオン(7.6 g、24.2ミリモル)を得た。

【0465】

パート4 {5-[(4-フルオロフェニルアミノ) -メチル] -4-p-トリル-4H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニル} -酢酸の調製

5-[(4-フルオロフェニルアミノ) -メチル] -4-p-トリル-2, 4-ジヒドロ-[1, 2, 4] トリアゾール-3-チオン(0.30 gm、0.95ミリモル)、
10
ブromo酢酸(0.13 gm、0.95ミリモル)および炭酸カリウム(0.16 gm、1.14ミリモル)のアセトン(6 mL)中混合物を40℃で3時間加熱し、次いで冷却した。反応を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、残留物を得た。残留物をシリカ上クロマトグラフィー(20%塩化メチレン中メタノール)により精製して、白色固体として{5-[(4-フルオロフェニルアミノ) -メチル] -4-p-トリル-4H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニル} -酢酸(0.27 gm、0.72ミリモル)を得た。

【0466】

方法CB

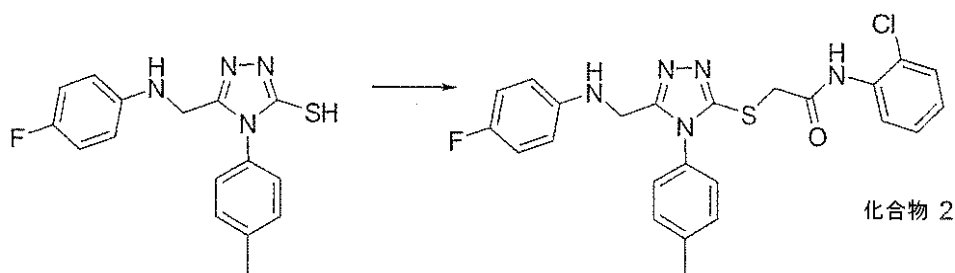
化合物C2 (スキームC5の化合物2)

N-(2-クロロフェニル)-2-{5-[(4-フルオロフェニルアミノ) -メチル] -4-p-トリル-4H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニル} -アセトアミド

【0467】

スキームC5

【化56】



パート1 N-(2-クロロフェニル)-2-{5-[(4-フルオロフェニルアミノ) -メチル] -4-p-トリル-4H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニル} -アセトアミドの調製

5-[(4-フルオロフェニルアミノ) -メチル] -4-p-トリル-2, 4-ジヒドロ-[1, 2, 4] トリアゾール-3-チオン(0.30 gm、0.95ミリモル)、
40
2-bromo-N-(2-クロロフェニル)-アセトアミド(0.24 gm、0.95ミリモル)および炭酸カリウム(0.16 gm、1.14ミリモル)のアセトン(6 mL)中混合物を40℃で3時間加熱し、次いで冷却した。反応を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、残留物を得た。残留物をシリカ上クロマトグラフィー(20%塩化メチレン中メタノール)により精製して、白色固体として、N-(2-クロロフェニル)-2-{5-[(4-フルオロフェニルアミノ) -メチル] -4-p-トリル-4H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニル} -アセトアミド(0.10 gm、0.20ミリモル)を得た。

【0468】

方法CC

10

20

30

40

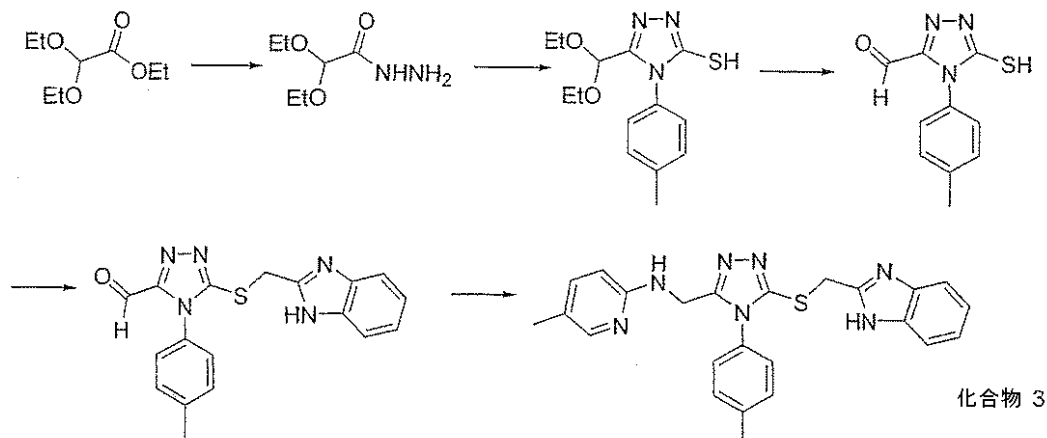
50

化合物 C 3 (スキーム C 6 の化合物 3)

【0469】

スキーム C 6

【化57】



10

[5-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチルスルファニル)-4-ポートリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルメチル]-(5-メチル-ピリジン-2-イル)-アミン

20

パート1 ジエトキシ酢酸ヒドラジドの調製

ジエトキシ酢酸エチル (15.8 g、90ミリモル) のエタノール (100 mL) 溶液を攪拌し、ヒドラジン (8.23 g、257ミリモル) を添加した。混合物を還流温度で2時間加熱し、次いで冷却し、真空下で濃縮した。残留物を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、透明油状物としてジエトキシ酢酸ヒドラジド (10.53 g、65ミリモル) を得た。

【0470】

パート2 5-ジエトキシメチル-4-ポートリル-2,4-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-3-チオンの調製

ポートルエンイソチオシアネート (9.7 g、65ミリモル) およびジエトキシ酢酸ヒドラジド (10.53 g、65ミリモル) を水性2N水酸化ナトリウム (100 mL) 中に溶解させ、数時間加熱し、次いで冷却した。溶液を6N塩酸で中和し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、黄色残留物を得た。残留物をn-ヘキサン (100 mL) で磨砕して、黄色固体として5-ジエトキシメチル-4-ポートリル-2,4-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-3-チオン (12.3 g、42ミリモル) を得た。

30

【0471】

パート3 5-チオキソ-4-ポートリル-4,5-ジヒドロ-1H-[1,2,4]トリアゾール-3-カルボアルデヒドの調製

5-ジエトキシメチル-4-ポートリル-2,4-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-3-チオン (5 g、17ミリモル) および水性3N HCl (30 mL) の1,4-ジオキサン (10 mL) 中溶液を攪拌し、40℃で2時間加熱し、次いで冷却した。混合物を水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、濃縮して、残留物を得た。フラッシュクロマトグラフィー (SiO₂、10% n-ヘキサン中アセトン) により精製して、黄色固体として、5-チオキソ-4-ポートリル-4,5-ジヒドロ-1H-[1,2,4]トリアゾール-3-カルボアルデヒド (2.6 g、11.8ミリモル) を得た。

40

【0472】

パート4 5-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチルスルファニル)-4-ポートリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-カルボアルデヒドの調製

50

5-チオキソ-4-p-トリル-4, 5-ジヒドロ-1H-[1, 2, 4]トリアゾール-3-カルボアルデヒド (2.6 g、1.8ミリモル) および 2-(クロロメチル)ベンゾイミダゾール (2.15 g、12.9ミリモル) のアセトン (10 mL) 中溶液を攪拌し、炭酸カリウム (2.07 g、15ミリモル) を添加した。混合物を 40℃ で 3 時間加熱し、次いで冷却した。混合物を水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、濃縮して、残留物を得た。フラッシュクロマトグラフィー (SiO₂、30% n-ヘキサン中アセトン) により精製して、白色固体として、5-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチルスルファニル)-4-p-トリル-4H-[1, 2, 4]トリアゾール-3-カルボアルデヒド (2.50 g、7.08ミリモル) を得た。

【0473】

10

パート 5 [5-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチルスルファニル)-4-p-トリル-4H-[1, 2, 4]トリアゾール-3-イルメチル]- (5-メチル-ピリジン-2-イル)-アミンの調製

5-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチルスルファニル)-4-p-トリル-4H-[1, 2, 4]トリアゾール-3-カルボアルデヒド (1.0 g、4.56ミリモル) および 2-アミノ-5-メチルピリジン (0.49 g、4.56ミリモル) の DMF/HOAc (10/1: v/v) (10 mL) 中溶液を室温で 1 時間攪拌した。ナトリウムシアノボロヒドリド (0.376 g、6.0ミリモル) を添加し、混合物を一夜攪拌した。混合物を水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、濃縮して、残留物を得た。フラッシュクロマトグラフィー (SiO₂、30% n-ヘキサン中アセトン) により精製して、灰白色固体として、[5-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチルスルファニル)-4-p-トリル-4H-[1, 2, 4]トリアゾール-3-イルメチル]- (5-メチル-ピリジン-2-イル)-アミン (0.108 g、0.25ミリモル) を得た。

20

実施例 D-4

【0474】

化合物 D-15

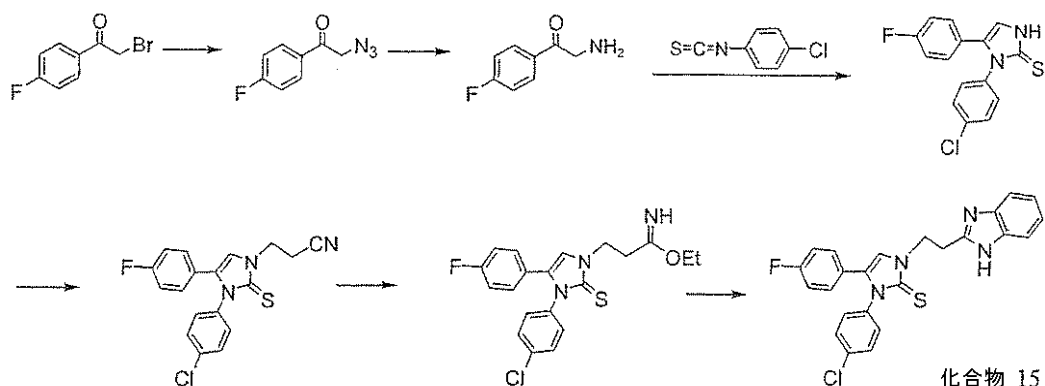
3-(2-(1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)エチル)-5-(4-フルオロフェニル)-1-p-トリル-1H-イミダゾール-2(3H)-チオン

【0475】

30

スキーム D-6

【化58】



40

パート 1 2-アジド-1-(4-フルオロフェニル)-エタノンの調製

2-ブロモ-1-(4-フルオロフェニル)-エタノン (1 当量) の DMSO 中溶液を 10℃ で激しく攪拌し、アジ化ナトリウム (1.25 当量) を添加する。混合物を 1 時間攪拌し、次いで水で急冷し、酢酸エチルで抽出する (2X)。合した有機層を水および食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮して、2-アジ

50

ド-1-(4-フルオロフェニル)-エタノンを得る。

【0476】

パート2 2-アミノ-1-(4-フルオロフェニル)-エタノン塩酸塩の調製

2-アジド-1-(4-フルオロフェニル)-エタノンのエタノール中溶液に、濃HCl(水性)および10%Pd/C(10モル%)を添加する。混合物を水素(H₂)雰囲気下、45psiで1時間攪拌する。セライトを通して混合物を濾過し、セライトケーキを大量のメタノールで洗浄する。溶媒を減圧下で除去し、得られた残留物をジエチルエーテルで磨砕し、濾過し、乾燥して、2-アミノ-1-(4-フルオロフェニル)-エタノン塩酸塩を得る。

【0477】

パート3 1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1H-イミダゾール-2-チオールの調製

2-アミノ-1-(4-フルオロフェニル)-エタノン塩酸塩(1当量)、4-クロロフェニルイソチオシアネート(1当量)および炭酸水素ナトリウム(1.5当量)のエタノール中混合物を90℃で2時間加熱する。溶媒を減圧下で除去する。得られた残留物を水性1N水酸化ナトリウム中に再懸濁させ、100℃で一夜加熱する。熱混合物を濾過し、冷却し、水性6N HClで慎重に酸性化する。得られた混合物を濾過して、1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1H-イミダゾール-2-チオールを得る。

【0478】

パート4 3-(5-(4-フルオロフェニル)-1,2-ジヒドロ-2-チオキソ-1-p-トリルイミダゾール-3-イル)プロパンニトリルの調製

5-(4-フルオロフェニル)-1-p-トリル-1H-イミダゾール-2-チオール(1当量)のジオキサン中混合物を攪拌し、Triton Bを添加する。混合物を70℃に加熱し、アクリロニトリル(1eq)を添加し、3時間加熱する。冷却された混合物を、水性0.1N HClおよび酢酸エチル間で分配する。有機層を水および食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥し、濾過し、溶媒を減圧下で除去する。フラッシュクロマトグラフィー(SiO₂)により、3-(5-(4-フルオロフェニル)-1,2-ジヒドロ-2-チオキソ-1-p-トリルイミダゾール-3-イル)プロパンニトリルを得る。

【0479】

パート5 3-(1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1,2-ジヒドロ-2-チオキソイミダゾール-3-イル)プロピオンイミド酸エチルエステルの調製

プロピオニトリルの1:1エタノール/ジエチルエーテル中溶液を氷水浴中で冷却し、HCl(g)を慎重に溶液中で10~20分にわたって発泡させる。反応混合物を室温で2~4時間攪拌し、溶媒を減圧下で除去して、3-(1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1,2-ジヒドロ-2-チオキソイミダゾール-3-イル)プロピオンイミド酸エチルエステルを得る。

【0480】

パート6 3-(2-(1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)エチル)-5-(4-フルオロフェニル)-1-p-トリル-1H-イミダゾール-2(3H)-チオンの調製

プロピオンイミド酸エチルエステルおよびベンゼン-1,2-ジアミンのエタノール中混合物を攪拌し、60℃で一夜加熱する。溶媒を減圧下で除去し；残留物を酢酸エチルおよび飽和水性重炭酸ナトリウム間で分配する。有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥し、濾過し、溶媒を減圧下で除去する。フラッシュクロマトグラフィー(SiO₂)により精製し、続いて、HCl塩を形成(メタノールおよび2Mエーテル性HCl)して、3-(2-(1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2-イル)エチル)-5-(4-フルオロフェニル)-1-p-トリル-1H-イミダゾール-2(3H)-チオン塩酸塩を得る。

10

20

30

40

50

【0481】

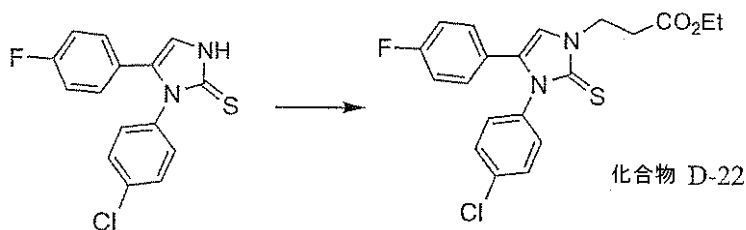
化合物 D-22

3-(1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1,2-ジヒドロ-2-チオソイミダゾール-3-イル)プロピオン酸エチルエステル

【0482】

スキーム D-7

【化59】



10

3-(1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1,2-ジヒドロ-2-チオソイミダゾール-3-イル)プロピオン酸エチルエステルの調製

1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1H-イミダゾール-2-チオール(1当量)のDMF中溶液に、リチウムビス(トリメチルシリル)アミドのTHF(1当量)中1M溶液および3-ブロモプロピオン酸エチル(1当量)を室温で添加する。混合物を60℃で2時間加熱し、室温に冷却する。混合物を水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮する。残留物をシリカ上クロマトグラフィーにより精製して、3-(1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1,2-ジヒドロ-2-チオソイミダゾール-3-イル)プロピオン酸エチルエステルを得る。

20

【0483】

化合物 D-26

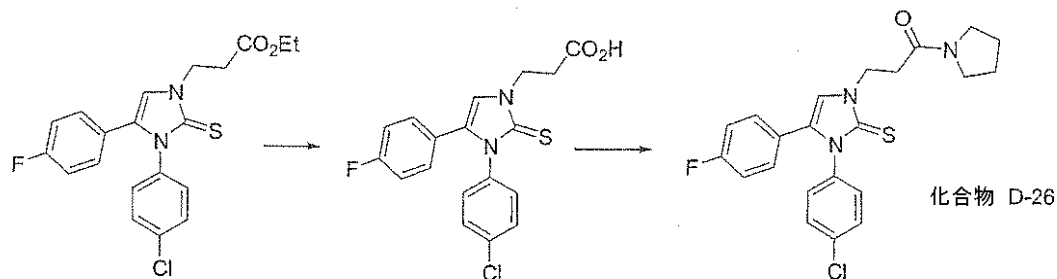
3-(1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1,2-ジヒドロ-2-チオソイミダゾール-3-イル)-1-(ピロリジン-1-イル)プロパン-1-オン

30

【0484】

スキーム D-8

【化60】



40

パート1 3-(1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1,2-ジヒドロ-2-チオソイミダゾール-3-イル)プロピオン酸の調製

3-(1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1,2-ジヒドロ-2-チオソイミダゾール-3-イル)プロピオン酸エチルエステル(1当量)および水酸化リチウム水和物(1.2当量)の混合物を1,4-ジオキサン:水(4/1:v/v)中に溶解させ、室温で3時間攪拌する。反応混合物を水性2N HClで中和し、酢酸エチルで抽出する。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、3-(1-(4-クロロフ

50

エニル) - 5 - (4-フルオロフェニル) - 1, 2-ジヒドロ-2-チオキソイミダゾール-3-イル) プロピオン酸を得る。

【0485】

パート2 3-(1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1, 2-ジヒドロ-2-チオキソイミダゾール-3-イル)-1-(ピロリジン-1-イル) プロパン-1-オンの調製

3-(1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1, 2-ジヒドロ-2-チオキソイミダゾール-3-イル) プロピオン酸 (1当量)、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 (1.7当量) およびモルホリン (1.7当量) のTHF中溶液を一夜室温で攪拌する。反応を水で急冷し、酢酸エチルで抽出する。有機物を乾燥し、真空下で濃縮する。残留物をシリカ上クロマトグラフィーにより精製して、3-(1-(4-クロロフェニル)-5-(4-フルオロフェニル)-1, 2-ジヒドロ-2-チオキソイミダゾール-3-イル)-1-(ピロリジン-1-イル) プロパン-1-オンを得る。

10

実施例 E-4

【0486】

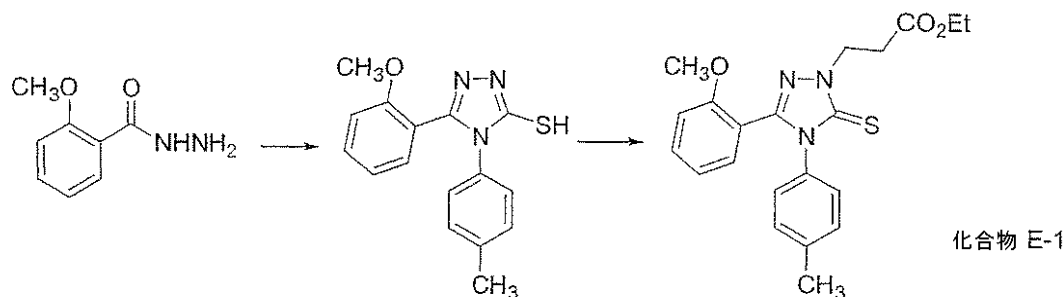
化合物 E-1

3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4, 5-ジヒドロ-[1, 2, 4] トリアゾール-1-イル]-プロピオン酸エチルエステル

【0487】

スキーム E-5

【化61】



30

パート1 5-(2-メトキシフェニル)-4-p-トリル-4H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-チオールの調製

2-メトキシベンズヒドラジド (7.0 gm、42ミリモル) および p-トリルイソチオシアネート (6.3 gm、42ミリモル) のエタノール (100 mL) 中混合物を還流温度で1時間加熱し、次いで冷却した。反応混合物を濾過し、フィルターケーキを冷エタノール (50 mL) で洗浄した。フィルターケーキを水性 2N 水酸化ナトリウム (100 mL) 中に溶解させ、一夜加熱し、次いで冷却した。溶液を 6N 塩酸で中和し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、白色固体を得た。固体をエタノール (100 mL) で磨砕して、白色固体として 5-(2-メトキシフェニル)-4-p-トリル-4H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-チオール (11 gm、37ミリモル) を得た。

40

【0488】

パート2 3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4, 5-ジヒドロ-[1, 2, 4] トリアゾール-1-イル]-プロピオン酸エチルエステルの調製

5-(2-メトキシフェニル)-4-p-トリル-4H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-チオール (0.9 g、30.3ミリモル) の DMF (100 mL) 中溶液に、リチウムビス(トリメチルシリル)アミドの THF (30.3 mL) 中 1M 溶液および 3-

50

ブロモプロピオン酸エチル（5.48 g、30.3ミリモル）を室温で添加した。混合物を60℃で1時間加熱し、室温に冷却した。混合物を水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮した。残留物をシリカ上クロマトグラフィー（20% n-ヘキサン中酢酸エチル）により精製して、透明油状物として3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-1-イル]-プロピオン酸エチルエステル（10.08 g、25.4ミリモル）を得た。

【0489】

化合物 E-2

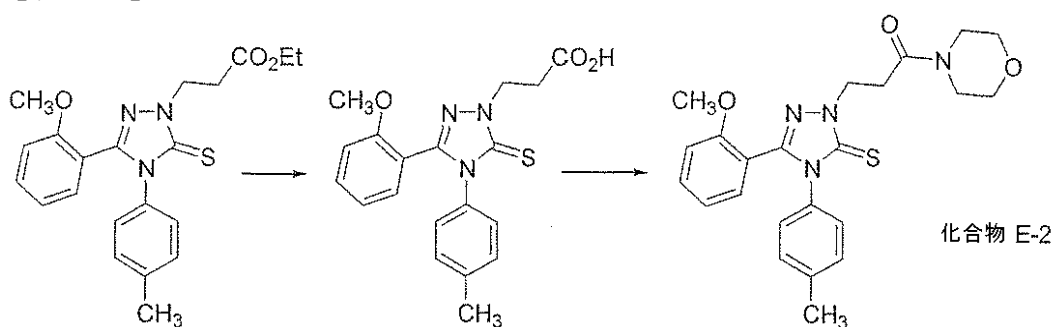
3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-1-イル]-1-モルホリン-4-イル-プロパン-1-オン

10

【0490】

スキーム E-6

【化62】



20

パート1 3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-1-イル]-プロピオン酸の調製

3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-1-イル]-プロピオン酸エチルエステル（10.08 g、25.4ミリモル）および水酸化リチウム水和物（1.28 g、30.48ミリモル）の混合物を1,4-ジオキサン：水（4/1：v/v）中に溶解させ、室温で3時間攪拌した。反応混合物を水性2N HClで中和し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、白色固体として、3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-1-イル]-プロピオン酸（8.99 g、24.4ミリモル）を得た。

30

【0491】

パート2 3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-1-イル]-1-モルホリン-4-イル-プロパン-1-オンの調製

3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-1-イル]-プロピオン酸（0.50 g、1.36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（0.388 g、2.03ミリモル）およびモルホリン（0.177 g、2.03ミリモル）のTHF（15 mL）中溶液を一夜室温で攪拌した。反応を水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮した。残留物をシリカ上クロマトグラフィー（20% n-ヘキサン中アセトン）により精製して、白色固体として、3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-1-イル]-1-モルホリン-4-イル-プロパン-1-オン（0.286 g、0.65ミリモル）を得た。

40

【0492】

50

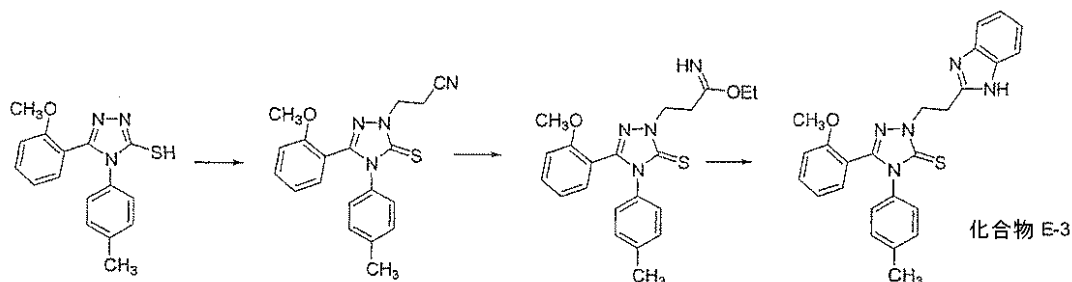
化合物 E-3

2-[2-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-エチル]-5-(2-メトキシフェニル)-4-p-トリル-2,4-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-3-チオン

【0493】

スキーム E-7

【化63】



10

パート1 3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-1-イル]-プロピオニトリルの調製

5-(2-メトキシフェニル)-4-p-トリル-2,4-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-3-チオン (1.1 g、3.7ミリモル) のジオキサン (6 mL) 中溶液を攪拌し、Triton B (20滴) を添加した。混合物を70℃で加熱し、アクリロニトリル (250 μL、3.7ミリモル) を添加し、さらに3時間加熱した。冷却された混合物を水性0.1N HCl (10 mL) および酢酸エチル (20 mL) 間で分配した。有機層を水 (10 mL) および食塩水 (10 mL) で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥し、濾過し、溶媒を減圧下で除去して、粘稠性黄色油状物を得た。フラッシュクロマトグラフィー (SiO₂、2:3 酢酸エチル/ヘキサン) により、白色泡状物として3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-1-イル]-プロピオニトリル (1 g、2.8ミリモル) を得た。

20

【0494】

パート2 3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-1-イル]-プロピオンイミド酸エチルエステルの調製

プロピオニトリル (0.5 g、1.4ミリモル) の1:1エタノール/ジエチルエーテル (20 mL) 中溶液を氷水浴中で冷却し、HCl (g) を溶液中に10~20分かけて慎重に発泡させた。反応混合物を室温で2~4時間攪拌し、溶媒を減圧下で除去して、粘稠性黄色油状物として、3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-1-イル]-プロピオンイミド酸エチルエステルを得た。油状物を精製せずに直接使用した。

30

【0495】

パート3 2-[2-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-エチル]-5-(2-メトキシフェニル)-4-p-トリル-2,4-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-3-チオンの調製

プロピオンイミド酸エチルエステルおよびベンゼン-1,2-ジアミン (0.227 g、2.1ミリモル) のエタノール (10 mL) 中混合物を攪拌し、60℃で一夜加熱した。溶媒を減圧下で除去し、残留物を酢酸エチル (20 mL) および飽和水性重炭酸ナトリウム (10 mL) 間で分配した。有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥し、濾過し、溶媒を減圧下で除去した。フラッシュクロマトグラフィー (SiO₂、1:1 酢酸エチル/ジクロロメタン) により、無色油状物を得た。油状物をメタノール (2 mL) 中に溶解させ、エーテル性2M HCl (10 mL) で処理した。溶媒を減圧下で除去して、白色固体とし

40

50

て化合物 E-3 (0.33 g) の一塩酸塩を得た。

【0496】

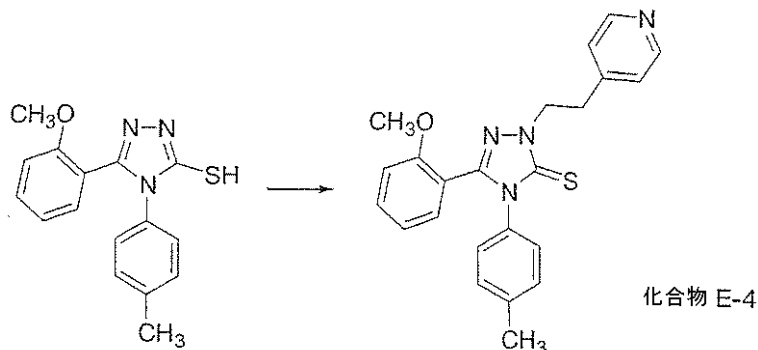
化合物 E-4

5-(2-メトキシフェニル)-2-(2-ピリジン-4-イルエチル)-4-p-トリル-2,4-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-3-チオン

【0497】

スキーム E-8

【化64】



10

パート1 5-(2-メトキシフェニル)-2-(2-ピリジン-4-イルエチル)-4-p-トリル-2,4-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-3-チオンの調製

20

5-(2-メトキシフェニル)-4-p-トリル-2,4-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-3-チオン (0.15 g、0.50 ミリモル) のエタノール (10 mL) 中混合物を攪拌し、4-ビニルピリジン (0.15 g、1.0 ミリモル) を添加した。混合物を一夜還流温度で加熱し、次いで冷却した。冷却された混合物を真空下で濃縮し、残留物を酢酸エチルで希釈した。有機物を水 (10 mL) および食塩水 (10 mL) で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥し、濾過し、溶媒を減圧下で除去して、粘稠性黄色油状物を得た。フラッシュクロマトグラフィー (SiO₂、20% 酢酸エチル/ヘキサン) により、白色固体として5-(2-メトキシフェニル)-2-(2-ピリジン-4-イルエチル)-4-p-トリル-2,4-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-3-チオン (0.04 g、0.09 ミリモル) を得た。

30

【0498】

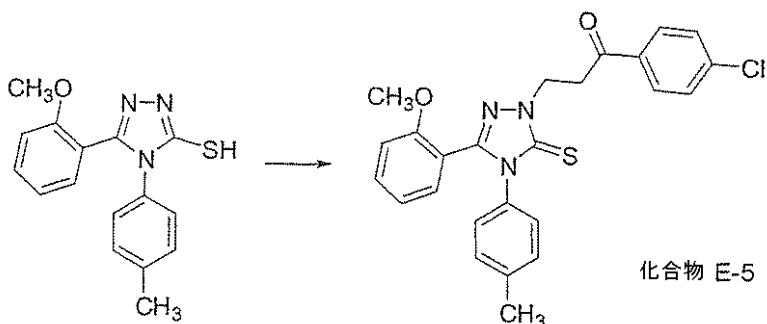
化合物 E-5

1-(4-クロロフェニル)-3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-1-イル]プロパン-1-オン

【0499】

スキーム E-9

【化65】



40

50

パート 1 1-(4-クロロフェニル)-3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-1-イル]-プロパン-1-オンの調製

5-(2-メトキシフェニル)-4-p-トリル-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール (0.45 g、1.5ミリモル) の DMF (10 mL) 中溶液に、リチウムビス(トリメチルシリル)アミドの THF (1.5 mL) 中 1 M 溶液およびベーター-4-ジクロロプロピオフェノン (0.30 g、1.5ミリモル) を室温で添加した。混合物を 60℃ で 1 時間加熱し、室温に冷却した。混合物を水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮した。残留物をシリカ上クロマトグラフィー (20% n-ヘキサン中酢酸エチル) により精製して、白色固体として、1-(4-クロロフェニル)-3-[3-(2-メトキシフェニル)-5-チオキソ-4-p-トリル-4,5-ジヒドロ-[1,2,4]トリアゾール-1-イル]-プロパン-1-オン (0.19 g、0.41ミリモル) を得た。

10

実施例 F-4

【0500】

化合物 F-1

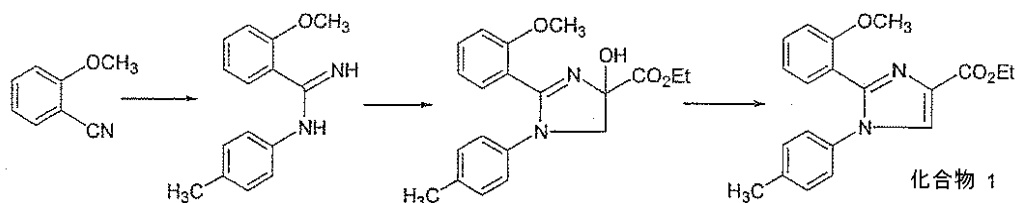
2-(2-メトキシフェニル)-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル (スキーム F-5 の化合物 1)

【0501】

スキーム F-5

20

【化66】



パート 1 2-メトキシ-N-p-トリル-ベンズアミジンの調製

ナトリウムビス(トリメチルシリル)アミドの THF (9.9 mL、1 M 溶液、9.9ミリモル) 中溶液に、室温でゆっくりと、p-トルイジン (1 g、9.3ミリモル) の乾燥 THF (5 mL) 中溶液を添加した。混合物を 20 分間攪拌した後、2-メトキシベンズニトリル (1.32 g、9.9ミリモル) の乾燥 THF (5 mL) 中溶液を添加した。反応混合物を 4 時間攪拌し、水で急冷した。混合物を酢酸エチルで 3 回抽出した。合した有機層を水、食塩水で洗浄し、無水 Na₂SO₄ 上で乾燥し、濾過し、真空下で濃縮して、赤色油状物として 2-メトキシ-N-p-トリル-ベンズアミジンを得、これをさらに精製せずに次の工程において使用した。

30

【0502】

パート 2 4-ヒドロキシ-2-(2-メトキシフェニル)-1-p-トリル-4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステルの調製

40

2-メトキシ-N-p-トリル-ベンズアミジン (340 mg、1.5ミリモル)、NaHCO₃ (378 mg、4.5ミリモル) の THF/水 (4/1: v/v、10 mL) 中混合物を還流温度で加熱した。プロモピルビン酸エチル (0.19 mL、1.5ミリモル) の THF (2 mL) 中溶液を 5 分かけて添加した。反応混合物を 2 時間還流させ、室温に冷却し、酢酸エチルで 3 回抽出した。合した有機層を、水、食塩水で洗浄し、無水 Na₂SO₄ 上で乾燥し、濾過し、真空下で濃縮して、褐色固体として 4-ヒドロキシ-2-(2-メトキシフェニル)-1-p-トリル-4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステルを得、精製せずに次の工程において使用した。

【0503】

パート 3 2-(2-メトキシフェニル)-1-p-トリル-1H-イミダゾール-

50

4-カルボン酸エチルエステルの調製

乾燥トルエン（50 mL）中4-ヒドロキシ-2-（2-メトキシフェニル）-1-p-トリル-4, 5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル（5 g、14.1ミリモル）のフラスコに、p-トルエンスルホン酸（268 mg、1.4ミリモル）を添加した。得られた混合物を、出発物質が消費されるまで還流させた。溶媒を真空下で除去し、得られた残留物を酢酸エチルおよび飽和水性NaHCO₃間で分配した。水性層を酢酸エチルで抽出した。合した有機層を水、食塩水で洗浄し、無水Na₂SO₄上で乾燥し、濾過し、真空下で濃縮し、クロマトグラフィー（SiO₂上、50%ヘキサン中酢酸エチル）により精製して、固体として2-（2-メトキシフェニル）-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル（4.5 g、13.4ミリモル）を得た。

10

【0504】

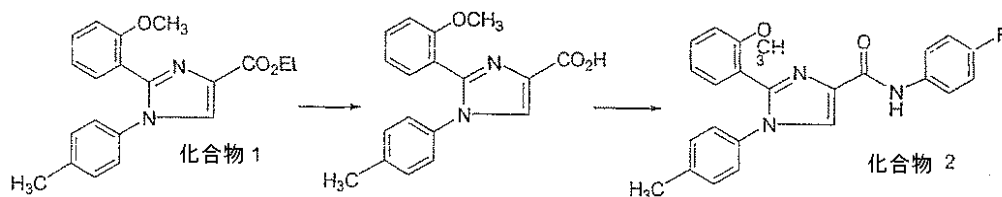
化合物F-2

2-（2-メトキシフェニル）-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸（4-フルオロフェニル）-メチル-アミド（スキームF-6の化合物2）

【0505】

スキームF-6

【化67】



20

パート1 2-（2-メトキシフェニル）-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸の調製

2-（2-メトキシフェニル）-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル（4.5 g、13.4ミリモル）のメタノール（10 mL）中溶液に、水性2N NaOH（10 mL）を添加した。混合物を1時間還流させ、室温に冷却した。溶媒を減圧下で部分的に除去した。残留物をpH3に酸性化し、塩化メチレンで3回抽出した。合した有機層を水、食塩水で洗浄し、無水Na₂SO₄上で乾燥し、濾過し、真空下で濃縮して、固体として、2-（2-メトキシフェニル）-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸（4.1 g、13.4ミリモル）を得た。

30

【0506】

パート2 2-（2-メトキシフェニル）-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸（4-フルオロフェニル）-アミドの調製

2-（2-メトキシフェニル）-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸（740 mg、2.4ミリモル）、4-フルオロアニリン（0.23 mL、2.4ミリモル）および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（920 mg、4.8ミリモル）を含有するフラスコに、ピリジン（10 mL）を添加した。混合物を室温で1時間攪拌し、揮発性有機物質を除去した。残留物を塩化メチレンおよび水間で分配した。合した有機層を水、食塩水で洗浄し、無水Na₂SO₄上で乾燥し、濾過し、真空下で濃縮した。クロマトグラフィー（SiO₂、30%ヘキサン中酢酸エチル）により、固体として、2-（2-メトキシフェニル）-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸（4-フルオロフェニル）-アミド（900 mg、2.2ミリモル）を得た。

40

【0507】

化合物F-3

（4-フルオロフェニル）-〔2-（2-メトキシフェニル）-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸（4-フルオロフェニル）-アミド〕

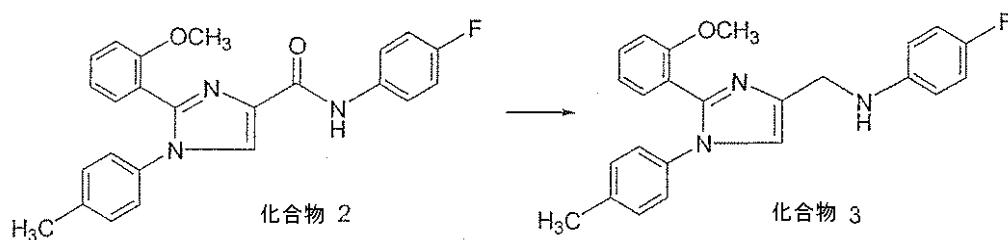
50

1 H-イミダゾール-4-イルメチル]-アミン (スキーム F-7 の化合物 3)

【0508】

スキーム F-7

【化68】



10

2-(2-メトキシフェニル)-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸 (4-フルオロフェニル)-アミド (250 mg、0.62 ミリモル) のトルエン (6 mL) 中溶液に、室温で、ボランジメチルスルフィド複合体 THF 溶液 (1.25 mL、2 M 溶液、2.5 mL) を添加した。混合物を一夜還流させた。冷却された反応混合物に、水性 1 N HCl を添加した。混合物を 30 分間還流させ、室温に冷却した。溶媒を減圧下で部分的に除去した。残留物を水性 1 N NaOH で中和し、塩化メチレンで 3 回抽出した。有機物を水、食塩水で洗浄し、無水 Na₂SO₄ 上で乾燥し、濾過し、真空下で濃縮した。クロマトグラフィー (SiO₂、30% ヘキサン中酢酸エチル) により、油状物として、(4-フルオロフェニル)-[2-(2-メトキシフェニル)-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-イルメチル]-アミン (210 mg、0.54 ミリモル) を得た。

20

【0509】

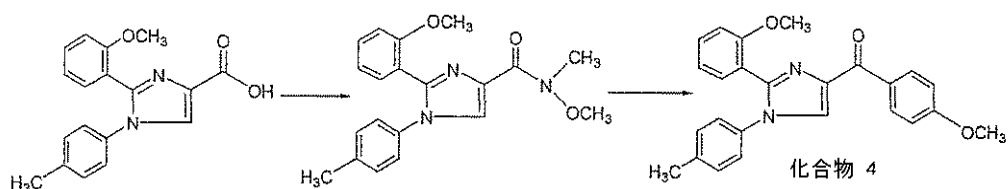
化合物 F-4

2-(2-メトキシフェニル)-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸メトキシメチルアミド (スキーム F-8 の化合物 4)

【0510】

スキーム F-8

【化69】



30

パート 1 2-(2-メトキシフェニル)-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸メトキシメチルアミドの調製

40

2-(2-メトキシフェニル)-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸 (200 mg、0.65 ミリモル) の塩化メチレン (5 mL) 中溶液に、(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 (250 mg、1.3 ミリモル)、トリエチルアミン (0.18 mL、1.3 ミリモル) および N,O-ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩 (63 mg、0.65 ミリモル) を添加した。混合物を一夜攪拌した。混合物を塩化メチレンおよび飽和水性 NaHCO₃ 間で分配した。合した有機層を水、食塩水で洗浄し、無水 Na₂SO₄ 上で乾燥し、濾過し、真空下で濃縮した。クロマトグラフィー (SiO₂、酢酸エチル) により、油状物として、2-(2-メトキシフェニル)-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸メトキシメチルアミド (220 mg、0.63 ミリモル) を得た。

50

【0511】

パート2 (4-メトキシフェニル) - [2 - (2-メトキシフェニル) - 1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-イル] - メタノンの調製

2 - (2-メトキシフェニル) - 1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸メトキシメチルアミド (110mg、0.31ミリモル) のTHF (2mL) 中溶液に、4-メトキシフェニルマグネシウムブロミドTHF溶液 (0.63mL、0.5M溶液、0.31ミリモル) をゆっくりと添加した。混合物を一夜攪拌した。さらに0.5Mの4-メトキシフェニルマグネシウムブロミドのTHF中溶液 (0.63mL、0.31ミリモル) を添加し、混合物を3時間攪拌し、水で急冷した。混合物を酢酸エチルで抽出した。合した有機層を水、食塩水で洗浄し、無水Na₂SO₄上で乾燥し、濾過し、真空下で濃縮した。逆相液体クロマトグラフィーとそれに続くプレートクロマトグラフィー (SiO₂、50% n-ヘキサン中酢酸エチル) により、泡状物質として、(4-メトキシフェニル) - [2 - (2-メトキシフェニル) - 1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-イル] - メタノン (9.1mg、0.04ミリモル) を得た。

10

【0512】

化合物 F-5

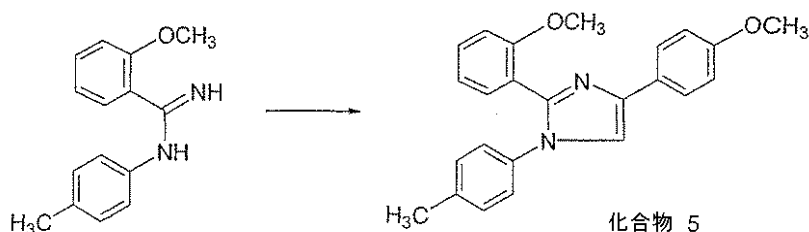
(4-メトキシフェニル) - 2 - (2-メトキシフェニル) - 1-p-トリル-1H-イミダゾール (スキーム F-9 の化合物 5)

【0513】

スキーム F-9

20

【化70】



2-メトキシ-N-p-トリル-ベンズアミジン (230mg、0.96ミリモル) のアセトニトリル (5mL) 中溶液に、NaHCO₃ (242mg、2.88ミリモル) を添加した。混合物を50℃に加熱した。2-ブロモ-1-(4-メトキシフェニル)-エタノン (220mg、0.96ミリモル) のアセトニトリル (2mL) 中溶液を滴下し、混合物を50℃で30分間攪拌し、3時間還流させた。溶媒を除去し、残留物をカラムクロマトグラフィー (SiO₂、30%ヘキサン中酢酸エチル) にかけて、固体として、(4-メトキシフェニル) - 2 - (2-メトキシフェニル) - 1-p-トリル-1H-イミダゾール (320mg、0.86ミリモル) を得た。

30

実施例 G-4

【0514】

本明細書の式の代表的化合物を、カルシウムチャンネルターゲットに対する活性について評価した。

40

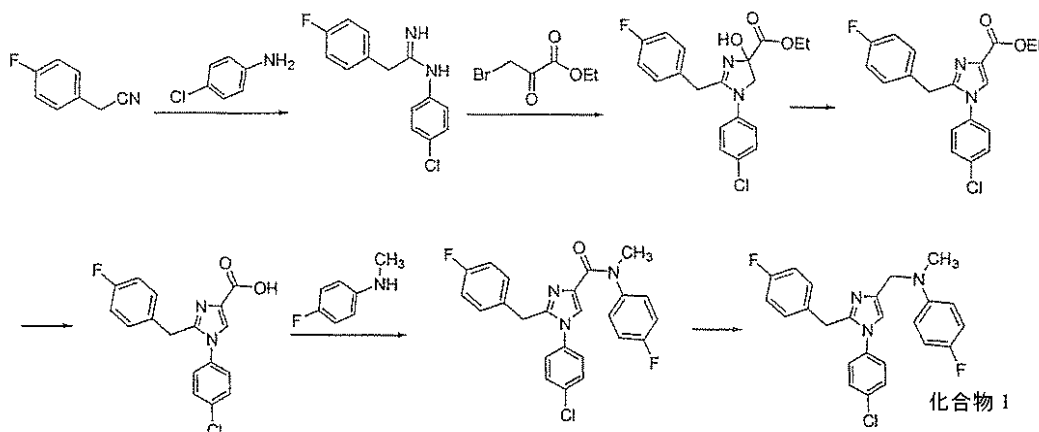
化合物 G-1

[1 - (4-クロロフェニル) - 2 - (4-フルオロベンジル) - 1H-イミダゾール-4-イルメチル] - (4-フルオロフェニル) - メチルアミン (スキーム G-6 の化合物 1)

【0515】

スキーム G-6

【化 7 1】



10

パート G-1 N-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロフェニル)-アセトアミジンの調製

トルエン (1000 mL) 中 4-クロロアニリン (54.0 g、424 ミリモル) に 0℃ で、トリメチルアルミニウム (トルエン中 2.0 M、200 mL、400 ミリモル) を滴下し、反応を 3 時間かけて、窒素下で室温に温めた。4-フルオロフェニルアセトニトリル (31.8 g、235 ミリモル) のトルエン (20 mL) 中溶液を添加し、混合物を 80℃ で一夜加熱した。混合物を室温に冷却し、クロロホルム (200 mL) および SiO₂ で処理し、スラリーを 1 時間攪拌し、SiO₂ のプラグ上に注いだ。5:10:85 水酸化アンモニウム:メタノール:塩化メチレンで溶出し、真空中で濃縮して、淡褐色固体を得た。酢酸エチル/ヘキサンから再結晶して、白色固体として N-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロフェニル)-アセトアミジン (54.5 g、207 ミリモル) を得た。

20

【0516】

パート G-2 1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-4-ヒドロキシ-4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステルの調製

N-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロフェニル)-アセトアミジン (6.2 g、24 ミリモル)、プロモピルビン酸エチル (10.1 g、52 ミリモル)、および炭酸水素ナトリウム (8.9 g、106 ミリモル) の THF (100 mL) および水 (100 mL) 中溶液を 4 時間還流させた。混合物を室温に冷却し、ジエチルエーテルで抽出した。有機物を乾燥し、真空中で濃縮して、暗褐色油状物を得た。酢酸エチル/ヘキサンから再結晶して、淡褐色固体として、1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-4-ヒドロキシ-4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル (1.8 g、4.7 ミリモル) を得た。

30

【0517】

パート G-3 1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステルの調製

1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-4-ヒドロキシ-4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル (1.8 g、4.7 ミリモル) および p-トルエンスルホン酸一水和物 (0.2 g、0.9 ミリモル) のトルエン (20 mL) 中溶液を 2 時間還流させた。混合物を室温に冷却し、溶媒を真空中で除去し、残留物を水および酢酸エチル間で分配した。有機物を乾燥し、真空中で濃縮して、暗赤色油状物を得、これをクロマトグラフィー (SiO₂、3% 塩化メチレン中メタノール) により精製して、1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル (1.6 g、4.4 ミリモル) を得た。

40

50

【0518】

パートG-4 1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-カルボン酸の調製

1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル(1.6g、4.4ミリモル)の1,4-ジオキサン(15mL)および水(15mL)中溶液に、水酸化リチウム水和物(0.4g、8.7ミリモル)を添加し、混合物を40℃で1時間撹拌した。殆どの1,4-ジオキサンを真空中で除去し、残留物を酢酸エチル/水中に溶かし、水性物を酢酸エチルで洗浄し、水性2N HClでpH2に酸性化し、沈殿1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-カルボン酸(1g、2.7ミリモル)を白色HCl塩として濾過により集めた。

10

【0519】

パートG-5 1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-カルボン酸(4-フルオロフェニル)-メチルアミドの調製

1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-カルボン酸(0.4g、1.3ミリモル)および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(0.3g、1.5ミリモル)および4-フルオロ-N-メチルアニリン(0.2g、1.4ミリモル)の塩化メチレン(10mL)中混合物を室温で4時間撹拌した。溶媒を真空中で除去し、残留物を水中に溶かし、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空中で濃縮し、残留物をクロマトグラフィー(SiO₂、3%塩化メチレン中メタノール)により精製して、1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-カルボン酸(4-フルオロフェニル)-メチルアミド(0.4g、0.9ミリモル)を得た。

20

【0520】

パート6 [1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-イルメチル]-(4-フルオロフェニル)-メチルアミンの調製

1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-カルボン酸(4-フルオロフェニル)-メチルアミド(0.3gm、0.7ミリモル)のTHF(10mL)中溶液に、0℃で、ボランジメチルスルフィド複合体(THF中2M、1.0mL、2.0ミリモル)を添加し、反応を還流温度で一夜加熱した。混合物を冷却し、メタノール性HCl(10mL)で希釈し、還流温度で1時間加熱し、冷却し、真空中で濃縮した。残留物を飽和水性重炭酸ナトリウムで希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、油状物を得た。クロマトグラフィー(SiO₂、3%塩化メチレン中メタノール)により精製して、油状物を得、これをエタノール中に溶かし、エーテル中HClで処理して、灰白色HCl塩として、1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-イルメチル]-(4-フルオロフェニル)-メチルアミン(0.1g、0.2ミリモル)を得た。

30

【0521】

化合物G-2

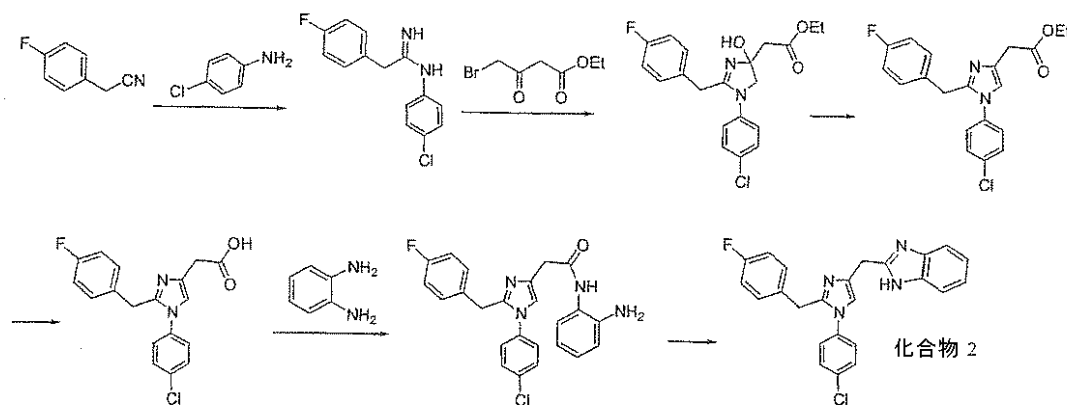
2-[1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-イルメチル]-1H-ベンゾイミダゾール(スキームG-7の化合物2)

【0522】

スキームG-7

40

【化 7 2】



10

パート G-1-5 N-(2-アミノフェニル)-2-[1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-イル]-アセトアミドの調製

N-(2-アミノフェニル)-2-[1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-イル]-アセトアミドをスキーム 6 と同様にして、パート 2 において、4-ブromoアセト酢酸エチルをブromoピルビン酸エチルに置換し、パート G-5 において、1, 2-フェニレンジアミンを 4-フルオロ-N-メチルアニリンと置換して、調製した。

20

【0523】

パート G-6 2-[1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-イルメチル]-1H-ベンゾイミダゾールの調製

N-(2-アミノフェニル)-2-[1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-イル]-アセトアミド (3.8 g、8.7 ミリモル) の氷酢酸 (10 mL) 中溶液を 70℃ で 0.5 時間加熱した。混合物を冷却し、飽和水性炭酸水素ナトリウムに滴下し、水酸化ナトリウムで pH を ~14 に調節し、酢酸エチルで抽出し、有機物を乾燥し、真空中で濃縮して、油状物を得た。エーテル中 HCl で処理し、続いてメタノール/エーテルから再結晶して、2-[1-(4-クロロフェニル)-2-(4-フルオロベンジル)-1H-イミダゾール-4-イルメチル]-1H-ベンゾイミダゾール (2.0 g、4.8 ミリモル) を白色 HCl 塩として得た。

30

実施例 H-4

【0524】

本明細書における式の代表的化合物をカルシウムチャンネルターゲットに対する活性について評価する。

化合物 H-1

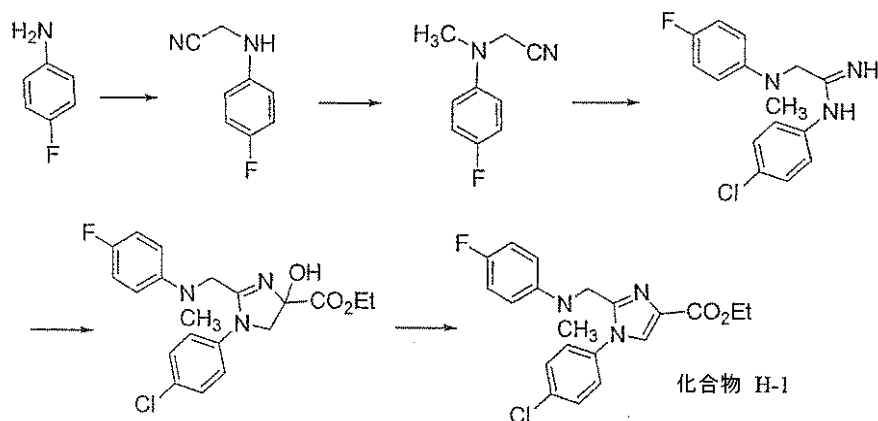
1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-メチル-アミノ]-メチル}-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル

40

【0525】

スキーム H-6

【化 7 3】



パート H-1 (4-フルオロフェニルアミノ)ーアセトニトリルの調製

4-フルオロアニリン (20.0 g、180 ミリモル) の氷酢酸 (250 mL) 中溶液に、パラホルムアルデヒド (14.06 g) およびシアン化カリウム (14.06 g、216 ミリモル) を 0℃ で数回に分けて添加した。混合物を室温で一晩攪拌し、冷却した。混合物を飽和水性重炭酸ナトリウムで中和し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮した。得られた残留物をクロマトグラフィー (SiO₂、10% n-ヘキサン中酢酸エチル) により精製して、黄色油状物として、(4-フルオロフェニルアミノ)ーアセトニトリル (22.9 g、153 ミリモル) を得た。

20

【0526】

パート H-2 [(4-フルオロフェニル)ーメチルーアミノ]ーアセトニトリルの調製

(4-フルオロフェニルアミノ)ーアセトニトリル (22.9 g、153 ミリモル) および炭酸セシウム (74.8 g、229 ミリモル) の THF (200 mL) 中スラリーに、ヨードメタン (10.5 mL、168 ミリモル) を添加した。混合物を 3 時間 40℃ で攪拌し、冷却し、水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、油状物として [(4-フルオロフェニル)ーメチルーアミノ]ーアセトニトリル (22.3 g、136 ミリモル) を得た。

30

【0527】

パート H-3 N-(4-クロロフェニル)ー2-[(4-フルオロフェニル)ーメチルーアミノ]ーアセトアミジンの調製

4-クロロアニリン (1.4 g、11.0 ミリモル) のトルエン (50 mL) 中溶液に、トリメチルアルミニウム (トルエン中 2 M; 5.3 mL、10.4 ミリモル) を 0℃、窒素ブランケット下で添加した。スラリーを 1 時間攪拌し、[(4-フルオロフェニル)ーメチルーアミノ]ーアセトニトリル (1.0 g、6.2 ミリモル) の溶液に室温で添加した。混合物を 80℃ で一晩加熱し、冷却し、シリカ/クロロホルム混合物のスラリーで急冷した。得られた混合物をシリカの短床上で濾過し、10% 塩化メチレン中メタノールで洗浄した。合したフラクションから、黄色油状物として、N-(4-クロロフェニル)ー2-[(4-フルオロフェニル)ーメチルーアミノ]ーアセトアミジン (1.21 g、4.18 ミリモル) を得た。

40

【0528】

パート H-4 1-(4-クロロフェニル)ー2-{[(4-フルオロフェニル)ーメチルーアミノ]ーメチル}ー4-ヒドロキシ-4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステルの調製

N-(4-クロロフェニル)ー2-[(4-フルオロフェニル)ーメチルーアミノ]ーアセトアミジン (1.21 g、4.18 ミリモル) の THF (40 mL) 中溶液に、水 (10 mL) 中重炭酸ナトリウム (0.70 g、8.36 ミリモル) を添加し、続いて

50

ブロモピルビン酸エチル (1.22 gm、6.27ミリモル) を40℃でゆっくりと添加した。添加後、反応を40℃で2時間加熱し、冷却した。混合物を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮した。得られた残留物をクロマトグラフィー (SiO₂、30% n-ヘキサン中酢酸エチル) により精製して、暗色油状物として、1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-メチルアミノ]-メチル}-4-ヒドロキシ-4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル (0.74 g、1.84ミリモル) を得た。

【0529】

パートH-5 1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-メチルアミノ]-メチル}-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステルの調製

1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-メチルアミノ]-メチル}-4-ヒドロキシ-4,5-ジヒドロ-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル (0.74 gm、1.84ミリモル) および p-トルエンスルホン酸一水和物 (0.1 gm) のトルエン (20 mL) 中混合物を、還流温度で1時間加熱した。混合物を冷却し、水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮した。得られた残留物をクロマトグラフィー (SiO₂、15% n-ヘキサン中アセトン) により精製して、白色固体として、1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-メチルアミノ]-メチル}-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル (0.63 g、1.62ミリモル) を得た。

【0530】

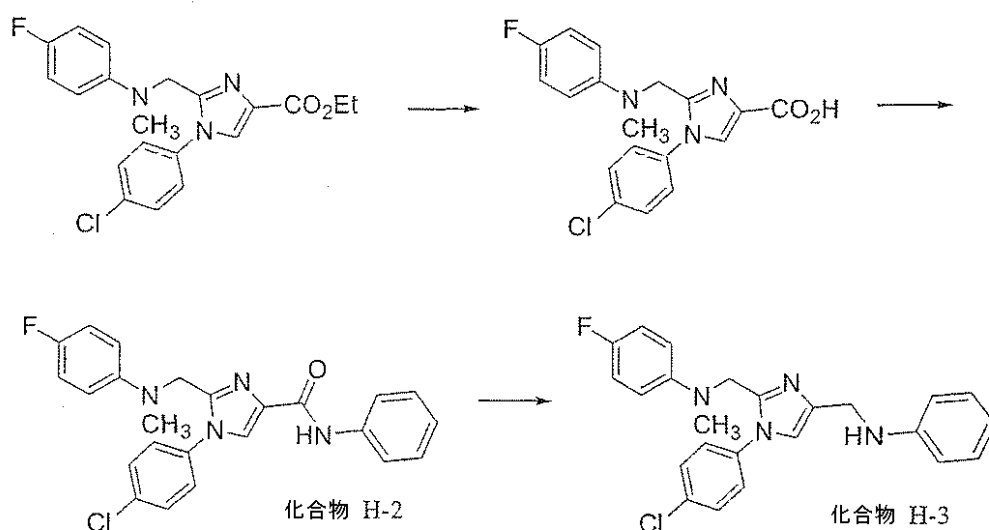
化合物H-2およびH-3

1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-メチルアミノ]-メチル}-1H-イミダゾール-4-カルボン酸フェニルアミドおよび [1-(4-クロロフェニル)-4-フェニルアミノメチル-1H-イミダゾール-2-イルメチル]-(4-フルオロフェニル)-メチルアミン

【0531】

スキームH-7

【化74】



パートH-1 1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-メチルアミノ]-メチル}-1H-イミダゾール-4-カルボン酸の調製

1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-メチルアミノ]-メチル}-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル (0.63 g、1.62ミリモル) および水酸化リチウム水和物 (0.14 g、3.24ミリモル) のメタ

ノール／水混合物（2：1／v：v）中溶液を50℃で1時間加熱し、冷却した。反応混合物を真空下で濃縮し、pHが6.5に達するまで、水性6N HClで希釈した。水性層を酢酸エチルで抽出し、有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、白色固体として、1-（4-クロロフェニル）-2-〔〔（4-フルオロフェニル）-メチル-アミノ〕-メチル〕-1H-イミダゾール-4-カルボン酸（0.41g、1.15ミリモル）を得た。

【0532】

パートH-2 1-（4-クロロフェニル）-2-〔〔（4-フルオロフェニル）-メチル-アミノ〕-メチル〕-1H-イミダゾール-4-カルボン酸フェニルアミドの調製

1-（4-クロロフェニル）-2-〔〔（4-フルオロフェニル）-メチル-アミノ〕-メチル〕-1H-イミダゾール-4-カルボン酸（0.36g、1.00ミリモル）および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（0.28g、1.5ミリモル）およびアニリン（0.09g、1ミリモル）のピリジン（4mL）中混合物を40℃で一夜加熱した。混合物を冷却し、水で急冷し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、固体として、1-（4-クロロフェニル）-2-〔〔（4-フルオロフェニル）-メチル-アミノ〕-メチル〕-1H-イミダゾール-4-カルボン酸フェニルアミド（0.31g、0.71ミリモル）を得た。

【0533】

パートH-3 〔1-（4-クロロフェニル）-4-フェニルアミノメチル-1H-イミダゾール-2-イルメチル〕-（4-フルオロフェニル）-メチル-アミンの調製

1-（4-クロロフェニル）-2-〔〔（4-フルオロフェニル）-メチル-アミノ〕-メチル〕-1H-イミダゾール-4-カルボン酸フェニルアミド（0.26g、0.6ミリモル）のTHF（15mL）中溶液に、ボラン-ジメチルスルフィド複合体（THF中2M；0.9mL）を添加し、一夜還流温度で攪拌した。混合物を冷却し、メタノール性HCl（10mL）で希釈した。混合物を再び還流温度で1時間加熱し、冷却し、真空下で濃縮して、残留物を得た。残留物を飽和水性重炭酸ナトリウムで希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、固体を得た。クロマトグラフィー（SiO₂、40%n-ヘキサン中アセトン）により精製して、白色固体として、〔1-（4-クロロフェニル）-4-フェニルアミノメチル-1H-イミダゾール-2-イルメチル〕-（4-フルオロフェニル）-メチル-アミン（0.07g、0.17ミリモル）を得た。

【0534】

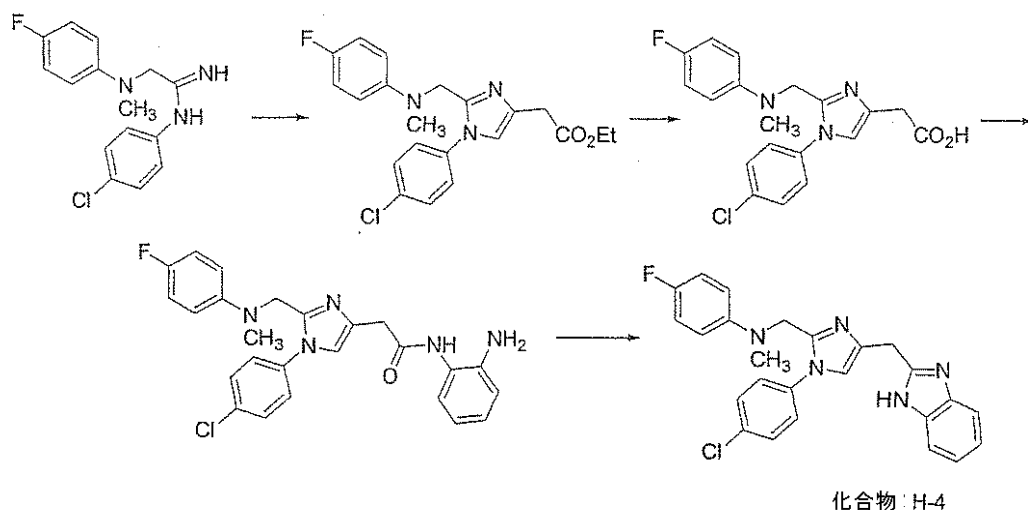
化合物H-4

〔4-（1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチル）-1-（4-クロロフェニル）-1H-イミダゾール-2-イルメチル〕-（4-フルオロフェニル）-メチル-アミン

【0535】

スキームH-8

【化 7 5】



10

パート H-1 (1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-メチル-アミノ]-メチル}-1H-イミダゾール-4-イル)-酢酸エチルエステルの調製

[1-(4-クロロフェニル)-4-フェニルアミノメチル-1H-イミダゾール-2-イルメチル]-(4-フルオロフェニル)-メチル-アミン(1当量)および炭酸水素カリウム(3当量)をアセトニトリル中に懸濁させた。懸濁液を50℃に加熱し、アセトニトリル中4-ブromo-3-オキソ-酪酸エチルエステル(1.5当量)をゆっくりと滴下した。反応混合物を2時間還流させ、冷却した。得られた残留物をクロマトグラフィー(SiO₂、ヘキサン中酢酸エチル)により精製して、[1-(4-クロロフェニル)-2-(2-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-4-イル]-酢酸エチルエステルを得た。

20

【0536】

パート H-2 (1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-メチル-アミノ]-メチル}-1H-イミダゾール-4-イル)-酢酸の調製

(1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-メチル-アミノ]-メチル}-1H-イミダゾール-4-イル)-酢酸エチルエステル(1当量)のTHF中溶液に、1N水性水酸化ナトリウム(5当量)を添加した。混合物を1時間70℃で攪拌し、冷却した。反応を水で希釈し、水性層のpHを、6N水性水酸化ナトリウムを用いて6に調節した。水性相を酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、乾燥し、真空下で濃縮して、(1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-メチル-アミノ]-メチル}-1H-イミダゾール-4-イル)-酢酸を得た。

30

【0537】

パート H-3 N-(2-アミノフェニル)-2-(1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-エチル-アミノ]-メチル}-1H-イミダゾール-4-イル)-アセトアミドの調製

(1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-メチル-アミノ]-メチル}-1H-イミダゾール-4-イル)-酢酸(1当量)および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(1.2当量)および1,2-フェニレンジアミン(1当量)のピリジン中混合物を室温で一夜攪拌した。溶媒を真空下で除去し、得られた残留物を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、濃縮し、残留物をシリカゲル上クロマトグラフィー(塩化メチレン中メタノール)により精製して、N-(2-アミノフェニル)-2-(1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-エチル-アミノ]-メチル}-1H-イミダゾール-4-イル)-アセトアミドを得た。

40

50

【0538】

パートH-4 [4-(1H-ベンゾイミダゾール-2-イルメチル)-1-(4-クロロフェニル)-1H-イミダゾール-2-イルメチル]-(4-フルオロフェニル)-メチルアミンの調製

N-(2-アミノフェニル)-2-(1-(4-クロロフェニル)-2-{[(4-フルオロフェニル)-エチルアミノ]-メチル}-1H-イミダゾール-4-イル)-アセトアミド(1当量)の水酢酸中溶液を70℃で30分間加熱する。混合物を冷却し、飽和水性重炭酸ナトリウム溶液を添加した。pHを水酸化ナトリウムペレットで7に調節し、水性層を酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、残留物を得た。残留物をエーテル中HClで処理して、HCl塩として、2-[1-(4-クロロフェニル)-2-(2-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-4-イルメチル]-1H-ベンゾイミダゾール(0.44g、0.98ミリモル)を得た。

10

実施例J-4

【0539】

化合物1

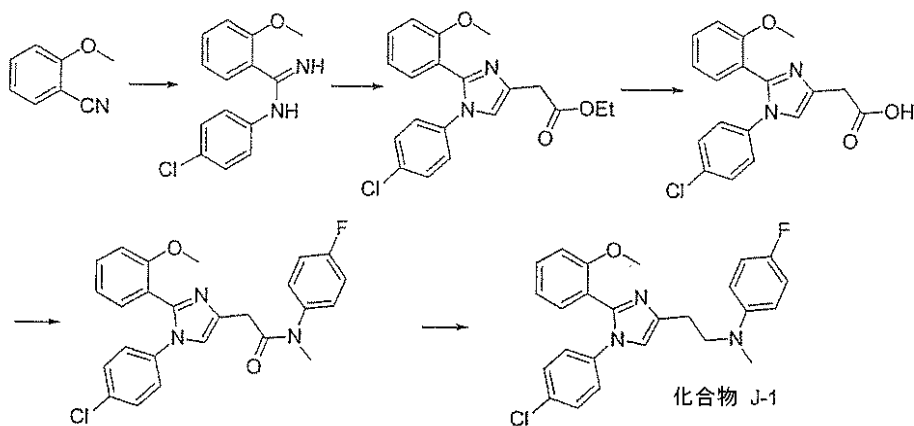
[1-(4-{2-[1-(4-クロロフェニル)-2-(2-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-4-イル]-エチル}-(4-フルオロフェニル)-メチルアミン

【0540】

スキームJ-6

20

【化76】



30

パートJ-1 N-(4-クロロフェニル)-2-メトキシベンズアミジンの調製
4-クロロアニリン(25g、197ミリモル)のTHF(250mL)中溶液に、0℃で、ナトリウムビス(トリメチルシリル)アミドのTHF中1M溶液(207mL、1.06当量)を30~60分にわたって滴下した。添加が完了した後、2-メトキシベンズニトリル(27.6g、209ミリモル)のTHF(125mL)中溶液を15~30分にわたって室温で滴下し、室温で1時間攪拌した。溶媒を減圧下で除去し、残留物を水および酢酸エチル間で分配した。合した有機物を食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥し、濾過し、溶媒を減圧下で除去して、暗色油状物を得、これは静置すると凝固した。ヘキサンおよび最小量の酢酸エチルで磨砕して、濾過後に、灰色固体として、N-(4-クロロフェニル)-2-メトキシベンズアミジン(34g、131ミリモル)を得た。

40

【0541】

パートJ-2 [1-(4-クロロフェニル)-2-(2-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-4-イル]-酢酸エチルエステルの調製

N-(4-クロロフェニル)-2-メトキシベンズアミジン(9g、34.6ミリモル)および炭酸水素カリウム(10.38g、103.8ミリモル、3当量)のアセト

50

ニトリル（100 mL）中50℃の混合物を、4-ブロモ-3-オキソ-酪酸エチルエステル（10 g、48ミリモル）のアセトニトリル（50 mL）中溶液で30分かけて滴下処理した。反応混合物を2時間還流にし、冷却し、濾過した。真空下で、溶媒を濾液から除去して、暗色油状物を得た。フラッシュクロマトグラフィー（SiO₂、50%ヘキサン中酢酸エチル）により、暗色粘稠性油状物として、[1-（4-クロロフェニル）-2-（2-メトキシフェニル）-1H-イミダゾール-4-イル]-酢酸エチルエステル（16 g、17ミリモル）を得た。

【0542】

パートJ-3 [1-（4-クロロフェニル）-2-（2-メトキシフェニル）-1H-イミダゾール-4-イル]-酢酸の調製

10

[1-（4-クロロフェニル）-2-（2-メトキシフェニル）-1H-イミダゾール-4-イル]-酢酸エチルエステル（1.5 g、4.04ミリモル）のTHF（40 mL）中溶液に、水性1N水酸化ナトリウム（12 mL）を添加し、混合物を1時間、70℃で攪拌し、冷却した。反応を水で急冷し、水性6N水酸化ナトリウムでpH6に調節し、酢酸エチルで抽出した。合した有機物を水で洗浄し、乾燥し、真空下で濃縮して、白色固体として[1-（4-クロロフェニル）-2-（2-メトキシフェニル）-1H-イミダゾール-4-イル]-酢酸（0.49 g、1.43ミリモル）を得た。

【0543】

パートJ-4 2-[1-（4-クロロフェニル）-2-（2-メトキシフェニル）-1H-イミダゾール-4-イル]-N-（4-フルオロフェニル）-N-メチルアセトアミドの調製

20

[1-（4-クロロフェニル）-2-（2-メトキシフェニル）-1H-イミダゾール-4-イル]-酢酸（0.25 g、0.73ミリモル）および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（0.28 g、1.46ミリモル）および4-フルオロ-N-メチルアニリン（0.082 mL、0.73ミリモル）のピリジン（3 mL）中混合物を室温で一夜攪拌した。溶媒を真空中で除去し、残留物を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、減圧下で濃縮し、残留物をクロマトグラフィー（SiO₂、3%塩化メチレン中メタノール）により精製して、油状物として2-[1-（4-クロロフェニル）-2-（2-メトキシフェニル）-1H-イミダゾール-4-イル]-N-（4-フルオロフェニル）-N-メチルアセトアミド（0.16 g、0.36ミリモル）を得た。

30

【0544】

パートJ-5 [1-（4-〔2-[1-（4-クロロフェニル）-2-（2-メトキシフェニル）-1H-イミダゾール-4-イル]-エチル〕-（4-フルオロフェニル）-メチルアミンの調製

2-[1-（4-クロロフェニル）-2-（2-メトキシフェニル）-1H-イミダゾール-4-イル]-N-（4-フルオロフェニル）-N-メチルアセトアミド（0.07 g、0.16ミリモル）のトルエン（5 mL）中溶液に、0℃で、ボラン-ジメチルスルフィド複合体（THF中2 M、0.16 mL、0.31ミリモル）を添加し、反応を還流温度で一夜加熱した。混合物を冷却し、メタノール性HCl（3 mL）で希釈し、還流温度1時間加熱し、冷却し、真空下で濃縮した。残留物を飽和水性重炭酸ナトリウムで希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、真空下で濃縮して、白色固体を得た。固体をメタノール中に溶かし、エーテル中HClで処理して、白色固体として[1-（4-〔2-[1-（4-クロロフェニル）-2-（2-メトキシフェニル）-1H-イミダゾール-4-イル]-エチル〕-（4-フルオロフェニル）-メチルアミン（0.06 g、0.013ミリモル）を得た。

40

【0545】

化合物J-2

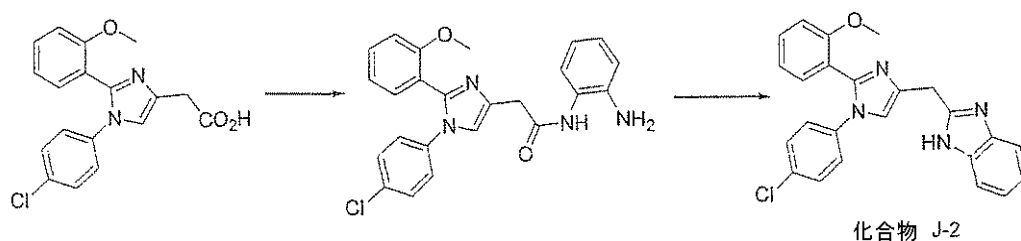
2-[1-（4-クロロフェニル）-2-（2-メトキシフェニル）-1H-イミダゾール-4-イルメチル]-1H-ベンゾイミダゾール

50

【0546】

スキーム J-7

【化77】



10

パート J-1 N-(2-アミノフェニル)-2-[1-(4-クロロフェニル)-2-(2-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-4-イル]-アセトアミドの調製

[1-(4-クロロフェニル)-2-(2-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-4-イル]-酢酸(0.87g、2.56ミリモル)および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(0.73g、3.83ミリモル)および1,2-フェニレンジアミン(0.28g、2.56ミリモル)のピリジン(5mL)中混合物を室温で一晩攪拌した。溶媒を真空中で除去し、水で処理し、飽和水性重炭酸ナトリウムで塩基性にし、酢酸エチルで抽出した。有機物を乾燥し、濃縮して、油状物としてN-(2-アミノフェニル)-2-[1-(4-クロロフェニル)-2-(2-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-4-イル]-アセトアミド(0.86g、1.99ミリモル)を得た。

20

【0547】

パート J-2 2-[1-(4-クロロフェニル)-2-(2-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-4-イルメチル]-1H-ベンゾイミダゾールの調製

N-(2-アミノフェニル)-2-[1-(4-クロロフェニル)-2-(2-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-4-イル]-アセトアミド(0.86g、1.99ミリモル)の水酢酸(8mL)中溶液を70℃で30分間加熱した。混合物を冷却し、飽和水性重炭酸ナトリウムに滴下し、水酸化ナトリウムペレットでpHを7に調節した。混合物を酢酸エチルで抽出し、有機物を乾燥し、真空中で濃縮して、油状物を得た。油状物をエーテル中HClで処理して、白色固体として2-[1-(4-クロロフェニル)-2-(2-メトキシフェニル)-1H-イミダゾール-4-イルメチル]-1H-ベンゾイミダゾール(0.44g、0.98ミリモル)を得た。

30

【0548】

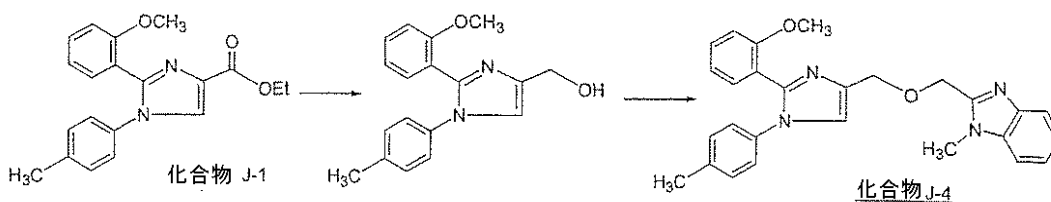
化合物 J-3

2-[2-(2-メトキシフェニル)-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-イルメトキシメチル]-1-メチル-1H-ベンゾイミダゾール

【0549】

スキーム J-8

【化78】



40

パート J-1 [2-(2-メトキシフェニル)-1-p-トリル-1H-イミダゾール-4-イル]-メタノールの調製

50

−78℃の2-(2-メトキシフェニル)-1-パートリル-1H-イミダゾール-4-カルボン酸エチルエステル(2.0g、6.0ミリモル)のTHF(10mL)中溶液に、1Mエーテル中水素化リチウムアルミニウム(6.0mL、6.0ミリモル)を滴下した。混合物を室温に温め、4時間攪拌し、3滴のメタノールで急冷した。溶媒を除去した。残留物を塩化メチレンおよび水間で分配した。合した有機層を水、食塩水で洗浄し、無水Na₂SO₄上で乾燥し、濾過し、真空下で濃縮した。カラムクロマトグラフィー(SiO₂、酢酸エチル)により、固体として[2-(2-メトキシフェニル)-1-パートリル-1H-イミダゾール-4-イル]-メタノール(1.1g、3.7ミリモル)を得た。

【0550】

パートJ-2 2-[2-(2-メトキシフェニル)-1-パートリル-1H-イミダゾール-4-イルメトキシメチル]-1-メチル-1H-ベンゾイミダゾールの調製

[2-(2-メトキシフェニル)-1-パートリル-1H-イミダゾール-4-イル]-メタノール(100mg、0.34ミリモル)のTHF(5mL)中溶液に、NaH(15mg、0.34ミリモル)を添加した。混合物を室温で30分間攪拌し、2-クロロメチル-1-メチル-1H-ベンゾイミダゾール(61mg、0.34ミリモル)を添加した。混合物を1時間還流させ、室温に冷却し、水で急冷した。混合物をエーテルで抽出した。有機層を水、食塩水で洗浄し、無水Na₂SO₄上で乾燥し、濾過し、真空下で濃縮した。カラムクロマトグラフィー(SiO₂、酢酸エチル)により、油状物として、2-[2-(2-メトキシフェニル)-1-パートリル-1H-イミダゾール-4-イルメトキシメチル]-1-メチル-1H-ベンゾイミダゾール(86mg、0.20ミリモル)を得た。

【0551】

本明細書における表中の化合物を、前記および一般的スキームに記載されるのと同様にして調製する。

化合物は本質的に前記および一般的スキームに記載されるようにして調製される。

本明細書において記載される、要約、記事、雑誌、刊行物、テキスト、論文、インターネットウェブサイト、データベース、特許、および特許公開物を包含するが、これらに限定されない全ての参考文献は、印刷物、電子、コンピューターに読み込み可能な記憶媒体または他の形態のいずれであっても、明確に、全体として本発明の一部として参照される。

【0552】

本発明を詳細な記載に関連して記載したが、前記記載事項は本発明を説明することを意図され、添付の請求の範囲により規定される本発明の範囲を制限することを意図されない。他の態様、利点、および修正は、以下の請求の範囲内に含まれる。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/US05/07667

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC(7) : C07D 233/44, 403/12 US CL : 548/306.1, 323.1, 324.5 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) U.S. : 548/306.1, 323.1, 324.5 Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) STN CAS ONLINE		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	US 5,444,081 A (GLEASON ET AL.) 22 August 1995 (22/08/95), see entire document.	1, 14 (all in-part)
☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.		
* Special categories of cited documents:		
"A"	document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"T"
"B"	earlier application or patent published on or after the international filing date	"X"
"L"	document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"Y"
"O"	document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	"Z"
"P"	document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	
Date of the actual completion of the international search 04 August 2005 (04.08.2005)		Date of mailing of the international search report 29 NOV 2005
Name and mailing address of the ISA/US Mail Stop PCT, Attn: ISA/US Commissioner for Patents P.O. Box 1430 Alexandria, Virginia 22313-1430 Facsimile No. (703) 305-3230		Authorized officer Laura L. Stockton, Ph.D. Telephone No. 571/272-1600

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (January 2004)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/US05/07667

Box No. II	Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of Item 2 of first sheet)
This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:	
1. ☐	Claims Nos.: because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. ☒	Claims Nos.: 1 and 14 because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically: Please See Continuation Sheet
3. ☐	Claims Nos.: because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).
Box No. III	Observations where unity of invention is lacking (Continuation of Item 3 of first sheet)
This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows: Please See Continuation Sheet	
1. ☐	As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐	As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐	As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☒	No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.: 1 and 14
Remark on Protest	☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest. ☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US05/07467

Continuation of Box II Reason 2:

In claim 1, numerous variables (e.g., R¹, R², Ar¹, Ar², etc.), their voluminous involved meanings, their large number of permutations and combinations and the list of compounds embraced by the language of claim 14 make it virtually impossible to determine the full scope for which protection is sought. As presented, the claimed subject matter cannot be regarded as being a concise description for which protection is sought and as such, the claims do not comply with the requirements of PCT Article 6. Thus, it is impossible to carry out a meaningful timely search on same. A search will be provided on the first discernable invention, which is compound number A1 found on page 48 of the instant specification. Compound number A1 embraces claims 1 and 14.

BOX III. OBSERVATIONS WHERE UNITY OF INVENTION IS LACKING

This application contains the following inventions or groups of inventions which are not so linked as to form a single general inventive concept under PCT Rule 13.1. In order for all inventions to be examined, the appropriate additional examination fees must be paid.

Group I, claim(s) 1 and 14, drawn to compounds of formula (AI).

Group II, claim(s) 2 and 14, drawn to compounds of formula (BI).

Group III, claim(s) 3, 4 and 14, drawn to compounds of formula (CI) and method of treating a disease.

Group IV, claim(s) 5 and 14, drawn to compounds of formula (DI).

Group V, claim(s) 6 and 14, drawn to compounds of formula (EI).

Group VI, claim(s) 7 and 12-14, drawn to compounds of formula (FI) and method of treating a disease by administering a compound of formula (FI).

Group VII, claim(s) 8, 9 and 14, drawn to compounds of formula (GI) and method of use.

Group VIII, claim(s) 10, 11 and 14, drawn to compounds of formula (HI) and method of use.

The inventions listed as Groups I-VIII do not relate to a single general inventive concept under PCT Rule 13.1 because, under PCT Rule 13.2, they lack the same or corresponding special technical features for the following reasons: the compounds defined in the claims lack a significant structural element qualifying as the special technical feature that defines a contribution over the prior art. The compounds claimed contain a nitrogen containing heterocyclic (i.e., imidazole, triazole, etc.) Which does not define a contribution over the prior art. The substituents on the nitrogen containing heterocyclic ring vary extensively and when taken as a whole result in vastly different compounds. Each of the groups set forth above represents a separate and discrete heterocyclic ring system which one skilled in the art which besides sharing no significant structural element, cannot be said to belong to a recognized class of chemical compounds.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US05/07667

Accordingly, the unity of invention is considered to be lacking and restriction of the invention in accordance with the rules of unity of invention is considered to be proper.

フロントページの続き

(51)Int.Cl.

F I

テーマコード (参考)

C O 7 D 403/06	(2006.01)	C O 7 D 403/06	
C O 7 D 233/84	(2006.01)	C O 7 D 233/84	
A 6 1 K 31/4164	(2006.01)	A 6 1 K 31/4164	
A 6 1 K 31/4178	(2006.01)	A 6 1 K 31/4178	
A 6 1 K 31/5377	(2006.01)	C O 7 D 249/12	5 0 9
C O 7 D 401/06	(2006.01)	A 6 1 K 31/5377	
A 6 1 K 31/4439	(2006.01)	C O 7 D 401/06	
C O 7 D 233/90	(2006.01)	A 6 1 K 31/4439	
A 6 1 P 9/10	(2006.01)	C O 7 D 233/90	A
A 6 1 P 9/12	(2006.01)	C O 7 D 233/64	1 0 5
A 6 1 P 9/04	(2006.01)	A 6 1 P 9/10	
A 6 1 P 3/10	(2006.01)	A 6 1 P 9/12	
A 6 1 P 13/02	(2006.01)	A 6 1 P 9/04	
A 6 1 P 13/10	(2006.01)	A 6 1 P 3/10	
A 6 1 P 11/00	(2006.01)	A 6 1 P 13/02	
A 6 1 P 25/28	(2006.01)	A 6 1 P 13/10	
A 6 1 P 25/00	(2006.01)	A 6 1 P 11/00	
A 6 1 K 45/00	(2006.01)	A 6 1 P 25/28	
		A 6 1 P 25/00	1 0 1
		A 6 1 K 45/00	

(31)優先権主張番号 60/551,473
 (32)優先日 平成16年3月8日(2004.3.8)
 (33)優先権主張国 米国(US)
 (31)優先権主張番号 60/551,372
 (32)優先日 平成16年3月8日(2004.3.8)
 (33)優先権主張国 米国(US)
 (31)優先権主張番号 60/551,480
 (32)優先日 平成16年3月8日(2004.3.8)
 (33)優先権主張国 米国(US)
 (31)優先権主張番号 60/551,395
 (32)優先日 平成16年3月8日(2004.3.8)
 (33)優先権主張国 米国(US)
 (31)優先権主張番号 60/551,474
 (32)優先日 平成16年3月8日(2004.3.8)
 (33)優先権主張国 米国(US)
 (31)優先権主張番号 60/551,620
 (32)優先日 平成16年3月8日(2004.3.8)
 (33)優先権主張国 米国(US)

(81)指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), EP(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW

- (72)発明者 ビンセント・ピー・ガルロ
アメリカ合衆国01560マサチューセッツ州サウス・グラフトン、ブラックストーン・レイン1
0番
- (72)発明者 クリストファー・トッド・ベイカー
アメリカ合衆国01730マサチューセッツ州ベッドフォード、カーブ・ストリート33番
- (72)発明者 ポール・ウィル
アメリカ合衆国01776マサチューセッツ州サドベリー、クリスタル・レイク・ドライブ35番
- (72)発明者 ウィリアム・ジェイ・フラジー
アメリカ合衆国53711-3141ウィスコンシン州マディソン、ミントン・ロード1114番
- (72)発明者 ホーモズ・マズディヤズニ
アメリカ合衆国01752マサチューセッツ州マールバーロウ、ブーフアード・ドライブ27番
- (72)発明者 グオ・ジンソン
アメリカ合衆国02148マサチューセッツ州モールデン、メイン・ストリート188番、アパー
トメント・エイ

Fターム(参考) 4C063 AA01 BB03 BB08 CC26 CC41 DD12 DD25 DD26 EE01
4C084 AA02 AA16 ZA362 ZA422
4C086 AA01 AA03 BC38 BC39 BC60 BC73 GA07 GA08 GA12 NA14
ZA02 ZA15 ZA36 ZA40 ZA42 ZA59 ZA81 ZB21 ZC35