

(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2007-502283

(P2007-502283A)

(43) 公表日 平成19年2月8日(2007.2.8)

(51) Int.C1.	F 1	テーマコード (参考)
COTD 213/75 (2006.01)	COTD 213/75	4C055
COTD 295/12 (2006.01)	COTD 295/12	CSPZ 4C069
COTD 233/32 (2006.01)	COTD 233/32	4C086
COTD 215/08 (2006.01)	COTD 215/08	
COTD 207/09 (2006.01)	COTD 207/09	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 249 頁) 最終頁に続く

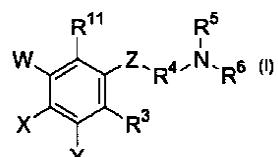
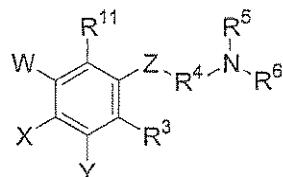
(21) 出願番号	特願2006-523322 (P2006-523322)	(71) 出願人	500203709
(86) (22) 出願日	平成16年8月11日 (2004.8.11)		アムジェン インコーポレイテッド
(85) 翻訳文提出日	平成18年4月12日 (2006.4.12)		アメリカ合衆国 カリフォルニア 913
(86) 國際出願番号	PCT/US2004/025970		20, サウザンド オークス, ワン
(87) 國際公開番号	W02005/019240		アムジェン センター ドライブ
(87) 國際公開日	平成17年3月3日 (2005.3.3)	(74) 代理人	100068526
(31) 優先権主張番号	60/494,855		弁理士 田村 恒生
(32) 優先日	平成15年8月13日 (2003.8.13)	(74) 代理人	100087114
(33) 優先権主張国	米国(US)		弁理士 斎藤 みの里
		(74) 代理人	100126778
			弁理士 品川 永敏

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】メラニン凝集ホルモン受容体アンタゴニスト

(57) 【要約】

式(I) :



[式中、W、X、Y、Z、R³～R⁶、およびR¹¹は明細書に定義するとおりである]

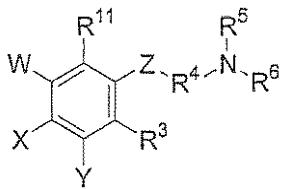
の新規化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグを提供する。メラニン凝集ホルモン媒介障害を処置または予防する方法であって、そのような処置または予防を必要とする対象に式Iの化合物を投与することを含む方法も提供する。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式Iの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグ：

【化 1】



10

I

[式中、

Wは、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

Xは、-OR¹、-NR¹R¹⁰、および-SR¹からなる群より選択される；

Yは、水素、-N(R⁷)C(O)NR²R⁸、-N(R⁷)C(O)OR²、-N(R⁷)C(O)R²、-N(R⁷)SO₂R²、および-NR²R⁷からなる群より選択される；

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)-、-C(O)N(R⁹)-、および-N(R¹²)C(O)N(R⁹)-からなる群より選択される；

R¹は、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアリールアルキルからなる群より選択され、R¹は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R²は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、アリールシクロアルキル、およびヘテロアリールアルキルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される不飽和縮合複素環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R³は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

R⁴は、結合、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、およびヘテロアリールアルキルからなる群より選択されるか、R⁴は、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、R⁴、またはR⁹と共に形成される環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、アルコキシカルボニル、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R⁵は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁵は、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

R⁶は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁶は、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

20

30

40

50

R^7 は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

R^8 は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる；

R^9 は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる； 10

R^{10} は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

R^{11} は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；そして

R^{12} は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される]。 20

【請求項 2】

W が、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択され；

R^1 が、低級アルキル、低級シクロアルキル、低級シクロアルキルアルキル、アリール、低級アラルキル、ヘテロアリール、および低級ヘテロアリールアルキルからなる群より選択され、 R^1 が、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシリ、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく； 30

R^2 が、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、低級アリールシクロアルキル、および低級ヘテロアリールアルキルからなる群より選択されるか、 R^2 が、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される不飽和縮合複素環が、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシリ、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^3 が、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択され； 40

R^4 が、結合、低級アルキル、低級アルケニル、低級アルキニル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、および低級ヘテロアリールアルキルからなる群より選択されるか、 R^4 が、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環が、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシリ、アリールオキシ、オキソ、低級アルコキシカルボニル、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^5 が、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリ 50

ールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁵が、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R⁶が、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁶が、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R⁷が、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択され；

R⁸が、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁸が、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ；

R⁹が、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁹が、R⁴およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R¹⁰が、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択され；

R¹¹が、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択され；そして

R¹²が、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される、

請求項1の化合物、薬学的に許容できる塩もしくは互変異性体。

【請求項3】

Wが、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、クロロ、ブロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択され；

10

20

30

40

50

R^1 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリルからなる群より選択され、 R^1 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^2 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルベンテニル、フェニルシクロプロピル、フェニルシクロブチル、フェニルシクロベンチル、フェニルシクロヘキシル、ビフェニルシクロプロピル、ビフェニルシクロブチル、ビフェニルシクロベンチル、ビフェニルシクロヘキシル、ナフチルシクロプロピル、ナフチルシクロブチル、ナフチルシクロベンチル、ナフチルシクロヘキシルからなる群より選択されるか、 R^2 が、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ヘキサヒドロイソインドリル、テトラヒドロイソインドリル、ジヒドロイソインドリル、イソインドリニル、ヘキサヒドロインドリル、テトラヒドロインドリル、ジヒドロインドリル、インドリニル、オクタヒドロキノリニル、ヘキサヒドロキノリニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、およびキノリニルからなる群より選択される環を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される環が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^3 が、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキ

10

20

30

40

50

シヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシベンチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択され；

R^4 が、結合、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、エテニル、ブロペニル、アリル、ブテニル、ペンテニル、アセチレン、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルベンテニルからなる群より選択されるか、 R^4 が、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^5 が、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシベンチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^5 が、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

R^6 が、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁶が、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

R⁷が、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択され；

R⁸が、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁸が、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、イソインドリニル環を形成することができ；

R⁹が、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル

10

20

30

40

50

ル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ベンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシペンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁹が、R⁴およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができます；

R^1 が、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリル、シクロプロビル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシリル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシリル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシリル、およびシアノからなる群より選択され；

R¹¹が、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリル、シクロプロビル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、ブロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシペンチル、ヒドロキシヘキシリル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシペンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシペンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシペンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシペンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシリル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシペンチル、カルボキシヘキシリル、およびシアノからなる群より選択され；そして

R^{12} が、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシペンチル、ヒドロ

キシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシベンチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシベンチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択される。

請求項2の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

10

【請求項4】

Xが-OR¹である、請求項1の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項5】

Xが-OR¹である、請求項2の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項6】

Xが-OR¹である、請求項3の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項7】

4-[(3,4-ジメチルフェニル)オキシ]-3-{[(フェニルアミノ)カルボニル]アミノ}-N-(2-(1-ピロリジニル)エチル)ベンズアミド、

4-[(3,4-ジメチルフェニル)オキシ]-3-[(3-フェニルプロパノイル)アミノ]-N-(2-(1-ピロリジニル)エチル)ベンズアミド、

4-[(3,4-ジメチルフェニル)オキシ]-3-([(フェニルメチル)アミノ]カルボニル)アミノ)-N-(2-(1-ピロリジニル)エチル)ベンズアミド、

4-(フェニルオキシ)-N-(2-(1-ピロリジニル)エチル)ベンズアミド、

3-アセチルアミノ-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-プロピオニルアミノ-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

3-(3-シクロペンチルプロピオニルアミノ)-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-フェニルアセチルアミノ-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-(3-フェニル-アクリロイルアミノ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-[(2-フェニル-シクロプロパンカルボニル)アミノ]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

ナフタレン-2-カルボン酸[2-(3,4-ジメチルフェノキシ)-5-(2-ピロリジン-1-イル-エチルカルバモイル)フェニル]アミド、

4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-(3-エチルウレイド)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

N-(2-アミノエチル)-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-(3-フェニルプロピオニルアミノ)ベンズアミド、

4-メトキシ-3-(3-フェニルプロピオニルアミノ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(ナフタレン-2-イル-オキシ)-3-(3-フェニルプロピオニルアミノ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-[3-(2-メトキシフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

3-[3-(2,4-ジクロロフェニル)ウレイド]-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

20

30

40

50

4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-[3-(4-フェノキシフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

3-(3-ビフェニル-4-イル-ウレイド)-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-[3-(4-イソプロピルフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-[3-(2,6-ジメチルフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

3-[3-(2,6-ジイソプロピルフェニル)ウレイド]-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

3-[3-(4-ブロモフェニル)ウレイド]-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-[3-(3-フルオロフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-[3-(3-メトキシフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

3-[3-(2-クロロフェニル)ウレイド]-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-(3,3-ジフェニルウレイド)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-(3-メチル-3-フェニルウレイド)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

1,3-ジヒドロイソインドール-2-カルボン酸[2-(3,4-ジメチルフェノキシ)-5-(2-ピロリジン-1-イル-エチルカルバモイル)フェニル]アミド、

4-(4-フルオロ-3-メチルフェノキシ)-3-[3-(3-フルオロフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(3,4-ジクロロフェノキシ)-3-[3-(3-フルオロフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(3,4-ジフルオロフェノキシ)-3-[3-(3-フルオロフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(4-フルオロフェノキシ)-3-[3-(3-フルオロフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

4-(3-フルオロフェノキシ)-3-[3-(3-フルオロフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

3-[3-(3-フルオロフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)-4-p-トリルオキシベンズアミド、

3-[3-(3-フルオロフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)-4-m-トリルオキシベンズアミド、

3-[3-(3,5-ジフルオロフェニル)ウレイド]-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

3-[3-(3,5-ジクロロフェニル)ウレイド]-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

3-[3-(3-フルオロフェニル)ウレイド]-4-フェノキシ-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド、

1-[2-(3,4-ジメチルフェノキシ)-5-(2-ピロリジン-1-イル-メチルピロリジン-1-カルボニル)フェニル]-3-フェニル尿素、

1-{2-(3,4-ジメチルフェノキシ)-5-[(2-ピロリジン-1-イル-エチルアミノ)-メチル]フェニル}-3-(3-フルオロフェニル)尿素、

10

20

30

40

50

1-[2-(3,4-ジメチルフェノキシ)-5-(2-ピロリジン-1-イル-メチルピロリジン-1-カルボニル)フェニル]-3-フェニル尿素、および

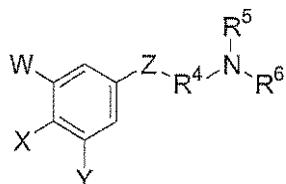
4-(3,4-ジクロロフェノキシ)-3-[3-(3,5-ジフルオロフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド

からなる化合物群より選択される請求項1の化合物、薬学的に許容できる塩、互変異性体またはプロドラッグ。

【請求項8】

式11：

【化2】



10

II

[式中、

Wは、水素、ヒドロキシ、アルキル、およびアルコキシからなる群より選択される；

Xは、-OR¹、-NR¹R¹⁰、および-SR¹からなる群より選択される；

Yは、水素、-N(R⁷)C(O)NR²R⁸、-N(R⁷)C(O)OR²、-N(R⁷)C(O)R²、-N(R⁷)SO₂R²、および-NR²R⁷からなる群より選択される；

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)-、-CH₂N(R⁹)-、および-N(R¹²)C(O)N(R⁹)-からなる群より選択される；

R¹は、アルキル、シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、R¹は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R²は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、およびアリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される不飽和縮合複素環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R⁴は、結合、アルキル、アルケニル、およびシクロアルキルからなる群より選択されるか、R⁴は、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、R⁴、またはR⁹と共に形成される環は、アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R⁵は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁵は、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

R⁶は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁶は、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

R⁷は、水素、アルキル、およびアリールからなる群より選択される；

R⁸は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁸は、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ；

R⁹は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁹は、R⁴およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成す

30

40

50

ることができる；

R^{10} は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択される；そして R^{12} は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択される】に相当する請求項1の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドレッゲ。

【請求項9】

Wが、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、および低級アルコキシからなる群より選択され；

R^1 が、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^1 が、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^2 が、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、および低級アリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^2 が、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される不飽和縮合複素環が、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^4 が、結合、低級アルキル、低級アルケニル、および低級シクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^4 が、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環が、低級アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^5 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^5 が、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R^6 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^6 が、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R^7 が、水素、低級アルキル、およびアリールからなる群より選択され；

R^8 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^8 が、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ；

R^9 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^9 が、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R^{10} が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択され；そして

R^{12} が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択される、

請求項8の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項10】

Wが、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、

10

20

30

40

40

50

メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、およびヘキシリオキシからなる群より選択され；

R^1 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリニアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、およびベンゾジオキソリルからなる群より選択され、 R^1 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、カルボキシリ、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^2 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリニアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシリメチル、シクロヘキシリエチル、シクロヘキシリプロピル、シクロヘキシリブチル、シクロヘキシリベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルペンテニル、フェニルシクロプロピル、フェニルシクロブチル、フェニルシクロベンチル、フェニルシクロヘキシリ、ビフェニルシクロプロピル、ビフェニルシクロブチル、ビフェニルシクロベンチル、ビフェニルシクロヘキシリ、ナフチルシクロプロピル、ナフチルシクロブチル、ナフチルシクロベンチル、ナフチルシクロヘキシリからなる群より選択されるか、 R^2 が、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ヘキサヒドロイソインドリル、テトラヒドロイソインドリル、ジヒドロイソインドリル、イソインドリニル、ヘキサヒドロイソインドリル、テトラヒドロイソインドリル、ジヒドロイソインドリル、インドリニル、オクタヒドロキノリニル、ヘキサヒドロキノリニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、およびキノリニルからなる群より選択される環を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される環が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、カルボキシリ、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^3 が、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシリ、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペント

10

20

30

40

50

キシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシリル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシリル、およびシアノからなる群より選択され；

R^4 が、結合、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリル、エテニル、ブロペニル、アリル、ブテニル、ペンテニル、アセチレニル、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシリルメチル、シクロヘキシリルエチル、シクロヘキシリルプロピル、シクロヘキシリルブチル、シクロヘキシリルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルベンテニルからなる群より選択されるか、 R^4 が、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、カルボキシリル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、ヘキシリオキシカルボニル、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^5 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、 R^5 が、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

R^6 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、 R^6 が、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

R^7 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、およびビフェニルからなる群より選択され；

R^8 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニル

10

20

30

40

50

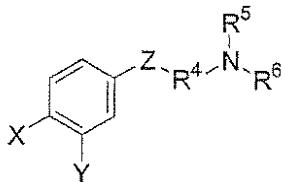
れる、

請求項9の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項 11】

式III:

【化 3】



10

III

[式中、

Xは、-OR¹および-SR¹からなる群より選択される；

Yは、水素、-N(R⁷)C(O)NR²R⁸、-N(R⁷)C(O)OR²、-N(R⁷)C(O)R²、-N(R⁷)SO₂R²、および-NR²R⁷からなる群より選択される；

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-CH₂N(R⁹)-、および-NHC(O)NR⁹-からなる群より選択される；

R¹は、アルキル、シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、R¹は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシリル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R²は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、およびアリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される不飽和縮合複素環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシリル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R⁴は、結合、アルキル、アルケニル、およびシクロアルキルからなる群より選択されるか、R⁴は、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、R⁴、またはR⁹と共に形成される環は、アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R⁵は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁵は、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

R⁶は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁶は、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

R⁷は、水素、アルキル、およびアリールからなる群より選択される；

R⁸は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁸は、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ；

R⁹は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁹は、R⁴およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

R¹⁰は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択される；そして

R¹²は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択される]

20

30

40

50

に相当する請求項1の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグ。

【請求項12】

R^1 が、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^1 が、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^2 が、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、および低級アリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^2 が、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される不飽和縮合複素環が、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^4 が、結合、低級アルキル、低級アルケニル、および低級シクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^4 が、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環が、低級アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^5 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^5 が、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R^6 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^6 が、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R^7 が、水素、低級アルキル、およびアリールからなる群より選択され；

R^8 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^8 が、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ；

R^9 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^9 が、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R^{10} が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択され；そして

R^{12} が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択される、

請求項11の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項13】

R^1 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリニアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、およびベンゾジオキソリルからなる群より選択され、 R^1 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒ

10

20

30

40

50

ドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^2 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルペンテニル、フェニルシクロプロピル、フェニルシクロブチル、フェニルシクロベンチル、フェニルシクロヘキシル、ビフェニルシクロプロピル、ビフェニルシクロブチル、ビフェニルシクロベンチル、ビフェニルシクロヘキシル、ナフチルシクロプロピル、ナフチルシクロブチル、ナフチルシクロベンチル、ナフチルシクロヘキシルからなる群より選択されるか、 R^2 が、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ヘキサヒドロイソインドリル、テトラヒドロイソインドリル、ジヒドロイソインドリル、イソインドリニル、ヘキサヒドロインドリル、テトラヒドロインドリル、ジヒドロインドリル、インドリニル、オクタヒドロキノリニル、ヘキサヒドロキノリニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、およびキノリニルからなる群より選択される環を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される環が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^3 が、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択され；

R^4 が、結合、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、エテニル、プロペニル、アリル、ブテニル、ペンテニル、アセチレン、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキ

10

20

30

40

50

サゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルペンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルブロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルペンチル、シクロヘキシリメチル、シクロヘキシリエチル、シクロヘキシリプロピル、シクロヘキシリベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルベンテニルからなる群より選択されるか、R⁴が、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ
10 R⁴、またはR⁹と共に形成される環が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、ヘキシリオキシカルボニル、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R⁵が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、R⁵が、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

R⁶が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、R⁶が、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

R⁷が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、およびビフェニルからなる群より選択され；

R⁸が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシリ、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、エトキシヘキシリ、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシリからなる群より選択されるか、R⁸が、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、イソインドリニル環
40
50

を形成することができ；

R^9 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、 R^9 が、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

R^{10} が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択され；そして

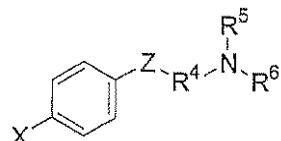
R^{12} が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択される、

請求項12の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項14】

式IV：

【化4】



10

20

30

40

50

IV

[式中、

Xは、-OR¹および-SR¹からなる群より選択される；

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-CH₂N(R⁹)²-、および-NHC(O)NR⁹-からなる群より選択される；

R¹は、アルキル、シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、R¹は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R²は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、およびアリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される不飽和縮合複素環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R⁴は、結合、アルキル、アルケニル、およびシクロアルキルからなる群より選択されるか、R⁴は、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、R⁴、またはR⁹と共に形成される環は、アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R⁵は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁵は、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

R⁶は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁶は、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

R⁷は、水素、アルキル、およびアリールからなる群より選択される；

R⁸は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁸は、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる；

R⁹は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁹は、R⁴およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

R¹⁰は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択される；そして

R¹²は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択される】に相当する請求項1の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグ。

【請求項 15】

R¹が、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、R¹が、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R²が、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、および低級アリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、R²が、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される不飽和縮合複素環が、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていても

10

20

30

40

50

よく；

R^4 が、結合、低級アルキル、低級アルケニル、および低級シクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^4 が、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環が、低級アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されてもよく；

R^5 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^5 が、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R^6 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^6 が、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R^7 が、水素、低級アルキル、およびアリールからなる群より選択され；

R^8 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^8 が、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ；

R^9 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^9 が、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R^{10} が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択され；そして

R^{12} が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択される、

請求項14の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項16】

R^1 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、およびベンゾジオキソリルからなる群より選択され、 R^1 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されてもよく；

R^2 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルブロピル、シクロブロピルブチル、シクロブロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルブロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルブロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシリブ

10

20

30

40

50

ロピル、シクロヘキシリブチル、シクロヘキシリベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルペンテニル、フェニルシクロプロピル、フェニルシクロブチル、フェニルシクロベンチル、フェニルシクロヘキシリ、ビフェニルシクロプロピル、ビフェニルシクロブチル、ビフェニルシクロベンチル、ビフェニルシクロヘキシリ、ナフチルシクロプロピル、ナフチルシクロブチル、ナフチルシクロベンチル、ナフチルシクロヘキシリからなる群より選択されるか、R²が、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ヘキサヒドロイソインドリル、テトラヒドロイソインドリル、ジヒドロイソインドリル、イソインドリニル、ヘキサヒドロインドリル、テトラヒドロインドリル、ジヒドロインドリル、インドリニル、オクタヒドロキノリニル、ヘキサヒドロキノリニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、およびキノリニルからなる群より選択される環を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される環が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシリ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ベンチルオキシ、ヘキシリオキシ、カルボキシリ、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R³が、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、ブロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ベンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシリ、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシリ、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシリ、およびシアノからなる群より選択され；

R⁴が、結合、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシリ、エテニル、プロペニル、アリル、ブテニル、ペンテニル、アセチレン、プロピニル、ブチニル、ベンチニル、ヘキシニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルブロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルブロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルブロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシリメチル、シクロヘキシリエチル、シクロヘキシリプロピル、シクロヘキシリブチル、シクロヘキシリベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルペンテニルからなる群より選択されるか、R⁴が、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ、R⁴、またはR⁹と共に形成される環が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシリ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ベンチルオキシ、ヘキシリオキシ、カルボキシリ、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオ

10

20

30

40

50

キシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^5 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロ pentachloroheptenyl、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、 R^5 が、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

R^6 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロ pentachloroheptenyl、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、 R^6 が、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

R^7 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、およびビフェニルからなる群より選択され；

R^8 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロ pentachloroheptenyl、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、 R^8 が、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、イソインドリニル環を形成することができ；

R^9 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロ pentachloroheptenyl、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択され；

10

20

30

40

50

るか、R⁹が、R⁴およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

R¹⁰が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択され；そして

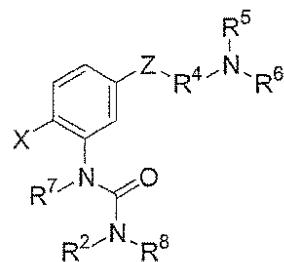
R¹²が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択される。

請求項15の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項 17】

式V：

【化5】



30

40

V

[式中、

Xは、-OR¹および-SR¹からなる群より選択される；

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-CH₂N(R⁹)₂-、および-NHC(O)NR⁹-からなる群より選択される；

R¹は、アルキル、シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、R¹は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R²は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、およびアリールシクロアルキルからなる群より選択され

50

るか、 R^2 は、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される不飽和縮合複素環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R^4 は、結合、アルキル、アルケニル、およびシクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^4 は、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環は、アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R^5 は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

R^6 は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

R^7 は、水素、アルキル、およびアリールからなる群より選択される；

R^8 は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる；そして

R^9 は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる】

に相当する請求項1の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドッグ。

【請求項 1 8】

R^1 が、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^1 が、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^2 が、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、および低級アリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^2 が、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される不飽和縮合複素環が、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^4 が、結合、低級アルキル、低級アルケニル、および低級シクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^4 が、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環が、低級アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^5 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^5 が、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R^6 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^6 が、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R^7 が、水素、低級アルキル、およびアリールからなる群より選択され；

R^8 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒ

10

20

30

40

50

ドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁸が、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ；そして

R⁹が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁹が、R⁴およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる。

請求項17の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項 19】

R¹が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリニアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、およびベンゾジオキソリルからなる群より選択され、R¹が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペニチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R²が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリニアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルペンテニル、フェニルシクロプロピル、フェニルシクロブチル、フェニルシクロベンチル、フェニルシクロヘキシル、ビフェニルシクロプロピル、ビフェニルシクロブチル、ビフェニルシクロベンチル、ビフェニルシクロヘキシル、ナフチルシクロプロピル、ナフチルシクロブチル、ナフチルシクロベンチル、ナフチルシクロヘキシルからなる群より選択されるか、R²が、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ヘキサヒドロイソインドリル、テトラヒドロイソインドリル、ジヒドロイソインドリル、イソインドリニル、ヘキサヒドロインドリル、テトラヒドロインドリル、ジヒドロインドリル、インドリニル、オクタヒドロキノリニル、ヘキサヒドロキノリニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、およびキノリニルからなる群より選択される環を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される環が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペニチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R⁴が、結合、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、エテニル、ブロペニル、アリル、ブテニル、ペンテニル、アセチレン、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリ

10

20

30

40

50

ル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロビルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルペンテニルからなる群より選択されるか、R⁴が、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ、R⁴、またはR⁹と共に形成される環が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ベンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、ベンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R⁵が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、R⁵が、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

R⁶が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、R⁶が、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

R⁷が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、およびビフェニルからなる群より選択され；

R⁸が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カル

10

20

30

40

50

ボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、R⁸が、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、イソインドリニル環を形成することができ；そして

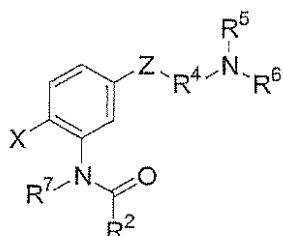
R⁹が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、R⁹が、R⁴およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる、

請求項18の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項 20】

式VI：

【化6】



[式中、

Xは、-OR¹および-SR¹からなる群より選択される；

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-CH₂N(R⁹)₂-、および-NHC(O)NR⁹-からなる群より選択される；

R¹は、アルキル、シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、R¹は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R²は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、およびアリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される不飽和縮合複素環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R⁴は、結合、アルキル、アルケニル、およびシクロアルキルからなる群より選択されるか、R⁴は、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、R⁴、またはR⁹と共に形成される環は、アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R⁵は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアラルキルからなる群より選択されるか、R⁵は、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

R⁶は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアラルキルからなる群より選択されるか、R⁶は、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全

10

20

30

40

50

体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

R^7 は、水素、アルキル、およびアリールからなる群より選択される；そして

R^9 は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる】

に相当する請求項1の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグ。

【請求項21】

R^1 が、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^1 が、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^2 が、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、および低級アリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^2 が、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される不飽和縮合複素環が、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^4 が、結合、低級アルキル、低級アルケニル、および低級シクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^4 が、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環が、低級アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^5 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^5 が、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R^6 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^6 が、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R^7 が、水素、低級アルキル、およびアリールからなる群より選択され；

R^8 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^8 が、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ；そして

R^9 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^9 が、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、

請求項20の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項22】

R^1 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、およびベンゾジオキソリルからなる群より選択され、 R^1 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒ

10

20

30

40

50

ドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^2 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルペンテニル、フェニルシクロプロピル、フェニルシクロブチル、フェニルシクロベンチル、フェニルシクロヘキシル、ビフェニルシクロプロピル、ビフェニルシクロブチル、ビフェニルシクロベンチル、ビフェニルシクロヘキシル、ナフチルシクロプロピル、ナフチルシクロブチル、ナフチルシクロベンチル、ナフチルシクロヘキシルからなる群より選択されるか、 R^2 が、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ヘキサヒドロイソインドリル、テトラヒドロイソインドリル、ジヒドロイソインドリル、イソインドリニル、ヘキサヒドロインドリル、テトラヒドロインドリル、ジヒドロインドリル、インドリニル、オクタヒドロキノリニル、ヘキサヒドロキノリニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、およびキノリニルからなる群より選択される環を形成することができ、 R^2 または R^8 と共に形成される環が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^4 が、結合、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、エテニル、ブロペニル、アリル、ブテニル、ペンテニル、アセチレン、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルペンテニルからなる群より選択されるか、 R^4 が、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ、 R^4 または R^9 と共に形成される環が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカル

10

20

30

40

50

ボニル、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^5 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシペンチル、ブトキシブチル、ブトキシペンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシペンチルからなる群より選択されるか、 R^5 が、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全體として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

R^6 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシペンチル、ブトキシブチル、ブトキシペンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシペンチルからなる群より選択されるか、 R^6 が、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全體として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

R^7 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、およびビフェニルからなる群より選択され；

R^8 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシペンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシペンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシペンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシペンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシペンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシペンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、 R^8 が、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全體として、イソインドリニル環を形成することができ；そして

R^9 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシペンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシペンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシペンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシペンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシペンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシペンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、 R^9 が、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全體として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる、

10

20

30

40

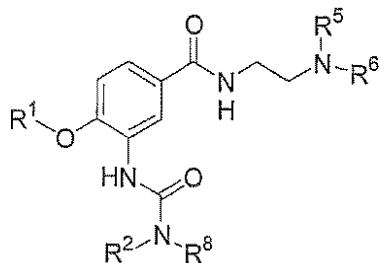
50

請求項21の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項23】

式VII:

【化7】



10

VII

[式中、

R^1 は、シクロアルキルおよびアリールからなる群より選択され、 R^1 は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R^2 は、アルキル、アリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、およびアリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^2 は、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される不飽和縮合複素環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

R^5 は、水素およびアルキルからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

R^6 は、水素およびアルキルからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；そして

R^8 は、水素、アルキル、シクロアルキル、およびアリールからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる]

20

に相当する請求項1の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラング。

【請求項24】

R^1 が、低級シクロアルキルおよびアリールからなる群より選択され、 R^1 が、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^2 が、低級アルキル、アリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、および低級アリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^2 が、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される不飽和縮合複素環が、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、アリールオキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^5 が、水素および低級アルキルからなる群より選択されるか、 R^5 が、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；

R^6 が、水素および低級アルキルからなる群より選択されるか、 R^6 が、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ；そして

R^8 が、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、およびアリールからなる群より選択されるか、 R^8 が、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、

30

40

50

請求項23の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項25】

R^1 が、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、およびビフェニルからなる群より選択され、 R^1 が、メチル、エチル、プロピル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^2 が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、フェニルエチル、シクロペンチルメチル、シクロペンチルエチル、シクロペンチルプロピル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルシクロプロピル、ビフェニルシクロプロピル、およびナフチルシクロプロピルからなる群より選択されるか、 R^2 が、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ジヒドロイソインドリル、ジヒドロインドリル、テトラヒドロイソキノリニル、およびテトラヒドロキノリニルからなる群より選択される環を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される環が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、フェノキシ、ナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^5 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、およびヘキシルからなる群より選択されるか、 R^5 が、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

R^6 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、およびヘキシルからなる群より選択されるか、 R^6 が、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；そして

R^8 が、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、およびビフェニルからなる群より選択されるか、 R^8 が、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ジヒドロイソインドリル、ジヒドロインドリル、テトラヒドロイソキノリニル、およびテトラヒドロキノリニルからなる群より選択される環を形成することができる。

請求項24の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項26】

R^1 が、フェニル、およびナフチルからなる群より選択され、 R^1 が、メチル、クロロ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^2 が、メチル、エチル、フェニル、ナフチル、ビフェニル、ベンジル、フェニルエチル、シクロペンチルエチル、フェニルエテニル、フェニルシクロプロピルからなる群より選択されるか、 R^2 が、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ジヒドロイソインドリル環を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される環が、メチル、プロピル、メトキシ、フェノキシ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよく；

R^5 が、水素であるか、 R^5 が、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環を形成し；

R^6 が、水素であるか、 R^6 が、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環を形成し；そして

R^8 が、水素、メチル、およびフェニルからなる群より選択されるか、 R^8 が、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ジヒドロイソインドリル環を形成することができ、

請求項25の化合物、薬学的に許容できる塩または互変異性体。

【請求項27】

請求項1～26のいずれか一項に記載の化合物、薬学的に許容できる塩、互変異性体またはプロドラッグと、薬学的に許容できる担体、佐剤、または希釈剤とを含む薬学的組成物。

10

20

30

40

50

【請求項 28】

対象におけるメラニン凝集ホルモン媒介障害を処置または予防する方法であって、そのような処置または予防を必要とする対象に、請求項1～26のいずれか一項に記載の化合物、薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグ、または請求項27の薬学的組成物を投与することを含む方法。

【請求項 29】

摂食障害、性障害、生殖障害、うつ病、不安、てんかん発作、高血圧、脳出血、うっ血性心不全、および睡眠障害からなる群より選択される状態を処置または予防する方法であって、そのような処置または予防を必要とする対象に、請求項1～26のいずれか一項に記載の化合物、薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグ、または請求項27の薬学的組成物を投与することを含む方法。 10

【請求項 30】

処置または予防される状態が摂食障害である、請求項29の方法。

【請求項 31】

摂食障害が、肥満、過食症および神経性大食症からなる群より選択される、請求項30の方法。

【請求項 32】

肥満を処置または予防する方法であって、そのような処置または予防を必要とする対象に、請求項1～26のいずれか一項に記載の化合物、薬学的に許容できる塩、互変異性体またはプロドラッグを投与することを含む方法。 20

【発明の詳細な説明】**【技術分野】****【0001】****発明の背景**

1999年現在、米国では成人の61%、小児（6歳～11歳）の13%および青年（12～19歳）の14%が過体重だった。全ての年齢群、人種群および民族群で、男性にも女性にも、過体重および肥満の発生率に増加が認められている。

【0002】

疫学的研究により、過体重および肥満に関連する死亡率の増加が示されている。肥満である人（ボディーマスインデックス（「BMI」）>30）は、BMIが20～25の範囲にある人と比較して、全死因による早期死亡のリスクが50～100%増加している。BMIは式：

$$\text{BMI} = 703 \times (\text{ポンドで表した体重}) / (\text{インチで表した身長})^2$$

に従って計算される。

【0003】

米国では年間推定300,000例の死が肥満に起因すると考えられる。過体重および肥満は、冠動脈心疾患、2型糖尿病、子宮内膜癌、大腸癌、閉経後乳癌、および他の癌、ならびに一定の筋骨格障害、例えば変形性膝関節症などのリスク増加と関連している。

【0004】

中程度の体重増加と大きな体重増加はどちらも疾患リスクの有意な増加と関連している。例えば、11～18ポンドの体重増加は、その人が2型糖尿病を発症するリスクを、体重増加がない人の2倍に増加させ、一方、44ポンド以上増加した人は、2型糖尿病のリスクが4倍になる。約10～20ポンドの増加は、冠動脈心疾患（非致命的心筋梗塞および死）のリスクを女性で1.25倍、男性で1.6倍にする。男性で22ポンドおよび女性で44ポンドというさらに高レベルの体重増加では、冠動脈心疾患リスクがそれぞれ1.75倍および2.65倍に増加する。BMIが34以上の女性では、子宮内膜癌を発症するリスクが6倍以上に増加する。過体重および肥満は、例えば高血圧および高コレステロールなどの多くの慢性状態を悪化させることも知られている。過体重の人および肥満の人は社会的非難、差別、および好ましくない身体像に苦しむ場合もある。肥満関連罹患は成人に最も高い頻度で起こるが、過剰体重の重大な結果および成人病の前触れは、過体重小児および過体重青年に起こる。過体重小児および過体重青年は、おそらく過体重成人および肥満成人になるだろう。この懸念は 40 50

は青年で最も高くなる。2型糖尿病、高血中脂質、および高血圧ならびに早熟および整形外科上の問題も、過体重若年層では発生頻度が高くなる。心理社会面に限定すると、小児過体重によく見られる結果は差別である。「The Surgeon General's Call To Action To Prevent and Decrease Overweight and Obesity(過体重および肥満を防止し減少させるための行動に対する公衆衛生局長官の呼びかけ)」米国保険社会福祉省(2001)参照。したがって、体重を管理し、肥満を処置する方法が必要とされている。

【背景技術】

【0005】

メラニン凝集ホルモン(MCH)は、より大きいMCHのプロホルモン前駆体Pmchから生じる環状の19アミノ酸視床下部神経ペプチドである。Pmch欠損マウスは痩せていて、食欲減退を示し、代謝率が増加している。Pmchを過剰発現させるトランスジェニックマウスは食欲亢進を示し、軽度肥満を発症する。したがってMCHは、運動活動、代謝、食物摂取および神経内分泌機能に対する作用によるエネルギー恒常性の調節に関連づけられている。

【0006】

MCHには2つの受容体が同定されており、MCH1受容体およびMCH2受容体と呼ばれている。MCH1受容体およびMCH2受容体は、MCH作用の原因であると考えられるGタンパク質共役受容体(GPCR)である。Gタンパク質は、数多くのエフェクタータンパク質の活性を調節するGTP結合型活性状態と、GDP結合型不活性状態との間を循環することによって、刺激に対する細胞の応答を制御する、ヘテロ三量体タンパク質である。GPCRは、GDP/GTP交換速度を上昇させることによって、Gタンパク質の活性化を加速する。

【0007】

MCH1受容体欠損マウスは正常体重を持つが、痩せていて、体脂肪量は少ない。驚くべきことに、通常飼料で維持した場合、MCH1受容体欠損マウスは食欲亢進を示し、それらの痩せは活動亢進および変化した代謝の結果である。活動亢進と整合して、MCH1受容体欠損マウスは、食餌誘発性肥満に対する感受性が低い。重要なことに、MCHの慢性中枢注入は野生型マウスに食欲亢進および軽度肥満を誘発するが、MCH1受容体欠損マウスではこれが起こらない。Marshら, *Proc. Nat. Acad. Sci.*, 99(5), 3241 (2002)。

【0008】

MCHは食物摂取およびエネルギー収支の重要な調節物質であることが示されているので、MCH受容体(特にMCH1受容体)の活性を調整することができる化合物は、摂食障害および代謝障害の処置にとって極めて望ましい。

【0009】

PCT公開番号W0 02/04433には、一定の代謝障害、摂食障害および性障害の処置に有用なMCH1受容体の調整物質として、フェニルシクロアルキルメチルアミノ誘導体およびフェニルアルケニルアミノ誘導体が記載されている。

【0010】

米国特許第6,472,394号には、肥満および糖尿病の処置に1,4-二置換ピペリジンのアミド誘導体をMCHアンタゴニストとして使用することが記載されている。

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0011】

発明の概要

したがって本発明の一定の実施形態のいくつかの目的のうち、メラニン凝集ホルモン受容体アンタゴニストの提供、メラニン凝集ホルモン受容体アンタゴニストを含む医薬組成物の提供、対象におけるメラニン凝集ホルモン媒介障害を処置し、予防し、または他の形で改善する方法の提供、対象における肥満を処置し、予防しまたは他の形で改善する方法の提供、および対象における持続的な体重減少を達成する方法の提供を挙げることができる。

【0012】

したがって簡単に述べると、本発明は、本明細書に定義する式Iのメラニン凝集ホルモ

10

20

30

40

50

ン受容体アンタゴニストに関する。

【0013】

また本発明は、本明細書に定義する式Iの化合物と、薬学的に許容できる担体、佐剤、または希釈剤とを含む薬学的組成物に関する。

【0014】

また本発明は、GPCRを阻害する方法であって、本明細書に定義する式Iの化合物をGPCRと接触させることを含み、式Iの化合物がGPCRリガンドの結合をインビトロで阻害するのに十分な濃度で存在する方法に関する。この方法には、例えばGPCRへのリガンドの結合をインビトロで阻害するのに十分であるだろう量の式Iの化合物を与えられた対象などにおいて、インビボで、GPCRを阻害することが含まれる。本発明に従って阻害することができるGPCRの例には、以下のGPCRファミリーが含まれるが、これらに限定されるわけではない：ムスカリン性アセチルコリン、アデノシン、アドレナリン作動性、アドレナリン作動性、アルファ-アドレナリン作動性、アンギオテンシン、AR、カンナビノイド、DA、ドーパミン、His、イミダゾリン、ロイコトリエン、mAch、MCH、オピオイド、セロトニン作動性、セロトニン、およびソマトスタチン。

【0015】

GPCRへのGPCRリガンドの結合の阻害は、数多くの障害、例えば消化管障害；粘液溶解喘息（mucolytic asthma）；不整脈；虚血；再灌流傷害；喘息、肺気腫および慢性気管支炎に関連する気管支痙攣；囊胞性線維症を含む急性および慢性呼吸器疾患；心臓興奮薬（cardiostimulant）；慢性気管支炎；神経症性うつ病；心不全；良性前立腺肥大；糖尿病；筋痙攣；心筋梗塞；脳卒中；アルツハイマー病；食欲不振；悪液質；多発性硬化症；高プロラクチン血症；向精神性（psychotropism）；眼検査および眼手術時の散瞳；欠陥性（deficitary）および産出性（productive）の統合失調症、神経衰弱および非内因性うつ病；腎臓疾患；血管拡張；慢性胃炎；緑内障；うつ病；アレルギー性鼻炎を含む鼻炎；がん性疼痛、筋骨格性疼痛、手術後痛を含む疼痛；眼疾患；消化不良；咳；胃腸潰瘍、胃潰瘍および食道潰瘍を含む潰瘍；ヘリコバクター・ピロリ予防感染（*helicobacter pylori prophylaxis infection*）；食道炎；喘息以外のアレルギーを含むアレルギー；感冒；喘息；結膜炎；じんま疹；下痢；クロイツフェルト・ヤコブ病；月経困難症；薬物嗜癖および薬物過量；敗血症性ショック処置；脳虚血；薬物中毒；頭部外傷；炎症；そう痒症；遅発性ジスキネジア；嘔吐；不安；運動機能不全；群発頭痛；高血圧；がん；過敏性腸症候群；血液療法誘発性の恶心および嘔吐；血栓症；痴呆；オピエート誘発性の恶心および嘔吐；双極性うつ病；片頭痛；睡眠障害；外傷性ショック；胃炎；胃食道逆流；精神病；パーキンソン病；依存症処置；子癇前症；レイノー病；血管痙攣；止血；恶心および嘔吐；痙攣；術後の恶心および嘔吐；アルコール依存症、アルコール嗜癖；過食症；ニコチン嗜癖；強迫性障害；パニック障害；心的外傷後ストレス障害；月経前症候群；ならびにアレルギー性皮膚炎を含む皮膚炎などの処置に有用である。

【0016】

また本発明は、MCH受容体へのMCHの結合を阻害する方法であって、式Iの化合物をMCH受容体を発現させる細胞と接触させることを含み、化合物がMCH受容体へのMCH結合をインビトロで阻害するのに十分な濃度で存在する方法に関する。この方法には、例えばMCH受容体へのMCHの結合をインビトロで阻害するのに十分であるだろう量の式Iの化合物を与えられた対象などにおいて、インビボで、MCH受容体へのMCHの結合を阻害することが含まれる。MCH受容体へのMCHの結合をインビトロで阻害するのに十分であるだろう式Iの化合物の量は、下記実施例24で説明するアッセイなどのMCH受容体結合アッセイによって、容易に決定することができる。

【0017】

また本発明は、MCH受容体のシグナル伝達活性（特にMCH受容体が媒介する細胞内カルシウム放出）を変化させる方法であって、そのような受容体を発現させる細胞を、有効量の本発明化合物にばく露することを含む方法に関する。この方法には、例えばMCH受容体のシグナル伝達活性をインビトロで変化させるのに十分であるだろう量の式Iの化合物を与

10

20

30

40

50

えられた対象などにおいて、インビボで、MCH受容体のシグナル伝達活性を変化させることが包含される。MCH受容体のシグナル伝達活性を変化させるのに十分であるだろう化合物の量は、下記実施例23で説明するカルシウム動員アッセイなどのMCH受容体シグナル伝達アッセイによって、容易に決定することができる。

【0018】

また本発明は、潜在的医薬が持つMCH受容体への結合能力の決定に、標準物質および試薬として、式Iの化合物および適切に標識されたその誘導体を使用する方法に関する。

【0019】

また本発明は、対象におけるメラニン凝集ホルモン媒介障害を処置、予防、または他の形で改善する方法であって、式Iの化合物または式Iの化合物と薬学的に許容できる担体、佐剤、もしくは希釈剤とを含む薬学的組成物を前記対象に投与することを含む方法に関する。10

【0020】

また本発明は、対象における肥満を処置または予防する方法であって、式Iの化合物または式Iの化合物と薬学的に許容できる担体、佐剤、もしくは希釈剤とを含む薬学的組成物を前記対象に投与することを含む方法に関する。

【0021】

また本発明は、肥満、過食症および神経性大食症を含む摂食障害；性障害もしくは生殖障害；うつ病および不安；てんかん発作；高血圧；脳出血；うつ血性心不全；睡眠障害などの状態、またはMCH受容体の拮抗が有益であるような任意の状態を処置または予防する方法に関する。20

【0022】

また本発明は、摂食障害（特に肥満および神経性大食症）を処置する方法であって、そのような処置を必要とする対象に、式Iの化合物をレプチニン、レプチニン受容体アゴニスト、またはメラノコルチニン受容体4(MC4)アゴニストと組み合わせて投与することを含む方法に関する。

【0023】

また本発明は、GPCR（特にMCH）の活性に関するアッセイにおいて、陽性対照として、式Iの化合物を使用する方法に関する。

【0024】

また本発明は、組織切片においてGPCR（特にMCH）を局在するためのプローブとして、適切に標識された式Iの化合物を使用する方法に関する。30

【0025】

他の目的および特徴は、一部は明白であり、一部は以下に指摘する。

【課題を解決するための手段】

【0026】

略号および定義

用語「アルキル」は、単独で用いられるか、「ハロアルキル」「アルキルスルホニル」「アルコキシアルキル」および「ヒドロキシアルキル」などの他の用語内で用いられる場合、炭素原子数1～約20（好ましくは炭素原子数1～約12）の直鎖または分枝鎖基である。より好ましいアルキル基は、炭素原子数1～約10の「低級アルキル」基である。最も好ましいのは、炭素原子数1～約6の低級アルキルラジカルである。そのようなラジカルの例として、メチル、エチル、プロピル（例えばn-プロピルおよびイソプロピル）、ブチル（例えばn-ブチル、イソブチル、sec-ブチル、およびtert-ブチル）、ペンチル（例えばn-ペンチルおよびイソアミル）、ヘキシルなどが挙げられる。40

【0027】

用語「シクロアルキル」は炭素原子数3～12の飽和炭素環式基である。シクロアルキル基は单環式、二環式または三環式であることができる。より好ましいシクロアルキル基は炭素原子数3～約8の「低級シクロアルキル」基である。そのような基の例として、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、およびシクロヘキシルが挙げられる。50

【0028】

用語「アルケニル」は、少なくとも1つの炭素-炭素二重結合を持つ炭素原子数2~約20(好ましくは炭素原子数2~約12)の直鎖または分枝鎖基である。より好ましいアルケニル基は、炭素原子数2~約6の「低級アルケニル」基である。アルケニル基の例として、エテニル、プロペニル、アリル、ブテニルおよび4-メチルブテニルが挙げられる。用語「アルケニル」および「低級アルケニル」は、「シス」配向および「トランス」配向、あるいは「E」配向および「Z」配向を持つ基でもある。

【0029】

用語「シクロアルケニル」は、炭素原子数3~12の部分不飽和炭素環式基である。シクロアルケニル基は単環式、二環式、または三環式であることができる。より好ましいシクロアルケニル基は、炭素原子数4~約8の「低級シクロアルケニル」基である。そのような基の例として、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロペンタジエニル、およびシクロヘキセニルが挙げられる。

【0030】

用語「アルキニル」は、少なくとも1つの炭素-炭素三重結合を持つ炭素原子数2~約20(好ましくは炭素原子数2~約12)の直鎖または分枝鎖基である。より好ましいアルキニル基は、炭素原子数2~約10の「低級アルキニル」基である。最も好ましいのは、炭素原子数2~約6の低級アルキニル基である。そのような基の例として、プロパルギル、ブチニルなどが挙げられる。

【0031】

用語「カルボキシ」または「カルボキシリ」は、単独で用いられるか、「カルボキシアルキル」のように、他の用語と共に用いられるかに関わらず、 $-CO_2H$ である。

【0032】

用語「カルボキシアルキル」は、カルボキシ基で置換された、上に定義したアルキル基である。より好ましいのは、「低級カルボキシアルキル」基であり、これはカルボキシ基で置換された、上に定義した低級アルキル基であって、アルキル基がさらにハロで置換されてもよい。そのような低級カルボキシアルキル基の例として、カルボキシメチル、カルボキシエチルおよびカルボキシプロピルが挙げられる。

【0033】

用語「ハロ」は、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素などのハロゲンである。

【0034】

用語「ハルアルキル」は、1以上の任意の炭素原子が上に定義したハロで置換されている、上に定義したアルキル基である。具体的には、モノハロアルキル基、ジハロアルキル基およびポリハロアルキル基が包含される。モノハロアルキル基は、一例として、ヨード、プロモ、クロロまたはフルオロ原子のいずれかを基内に持ちうる。ジハロアルキル基およびポリハロアルキル基は、2以上の同じハロ原子または異なるハロ基の組合せを持ちうる。より好ましいハロアルキル基は、炭素原子数1~6の「低級ハロアルキル」である。低級ハロアルキル基の例として、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、トリクロロメチル、ペンタフルオロエチル、ヘプタフルオロプロピル、ジフルオロクロロメチル、ジクロロフルオロメチル、ジフルオロエチル、ジフルオロプロピル、ジクロロエチルおよびジクロロプロピルが挙げられる。

【0035】

用語「アルコキシ」および「アルキルオキシ」は、それぞれ炭素原子数1~約10のアルキル部分を持つ直鎖または分枝鎖オキシ含有基である。より好ましいアルコキシ基は、炭素原子数1~6の「低級アルコキシ」基である。そのような基の例として、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシおよびtert-ブトキシが挙げられる。「アルコキシ」基は、1以上のハロ原子(例えばフルオロ、クロロまたはプロモ)でさらに置換されて、ハロアルコキシ基になっていてもよい。より好ましいハロアルコキシ基は、1以上のハロ基を持つ炭素原子数1~6の「低級ハロアルコキシ」基である。そのような基の例として、フルオロ

10

20

30

40

50

メトキシ、クロロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシ、フルオロエトキシおよびフルオロプロボキシが挙げられる。

【0036】

用語「アルコキシアルキル」は、1以上のアルコキシ基が結合しているアルキル基、すなわち、結果としてモノアルコキシアルキル基およびポリアルコキシアルキル基を形成しているアルキル基である。より好ましいアルコキシアルキル基は、炭素原子数2~12の「低級アルコキシアルキル」基である。そのような基の例として、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、ジメトキシメチル、ジメトキシエチル、メトキシ(エトキシ)エチル、ジメトキシプロピル、およびメトキシ(エトキシ)プロピルが挙げられる。

10

【0037】

用語「アルコキシカルボニル」は、酸素原子を介してカルボニル基に結合している、上に定義したアルコキシ基を含有する基、すなわちエステル基である。より好ましいのは、炭素数1~6のアルキル部分を持つ「低級アルコキシカルボニル」基である。そのような低級アルコキシカルボニル基の例として、置換または無置換メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニルおよびヘキシリオキシカルボニルが挙げられる。

【0038】

用語「ヒドロキシアルキル」は、1以上のヒドロキシル基で置換されてもよい炭素原子数1~約10の直鎖または分枝鎖アルキル基である。より好ましいヒドロキシアルキル基は、1以上のヒドロキシル基を持つ炭素原子数1~6の「低級ヒドロキシアルキル」基である。そのような基の例として、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチルおよびヒドロキシヘキシルが挙げられる。

20

【0039】

用語「アルキルアミノ」は、1個または2個のアルキル基で置換されているアミノ基である。好ましいのは、炭素原子数1~6のアルキル部分を持つ「低級N-アルキルアミノ」基である。好適な低級アルキルアミノは、例えばN-メチルアミノ、N-エチルアミノ、N,N-ジメチルアミノ、N,N-ジエチルアミノなどのモノアルキルアミノまたはジアルキルアミノでありうる。

【0040】

用語「アルキルアミノアルキル」は、アミノアルキル基の窒素原子に結合した1以上のアルキル基を持つ基である。

30

【0041】

用語「アルキルアミノカルボニル」は、アミノ窒素原子が1個または2個のアルキル基で置換されているアミノカルボニル基である。好ましいのは、「N-アルキルアミノカルボニル」基、「N,N-ジアルキルアミノカルボニル」基である。より好ましいのは、上に定義した低級アルキル部分を持つ「低級N-アルキルアミノカルボニル」基および「低級N,N-ジアルキルアミノカルボニル」基である。

【0042】

用語「アルキルチオ」は、二価硫黄原子に結合した炭素原子数1~約10のアルキル基を含有する基である。より好ましいアルキルチオ基は、炭素原子数1~6のアルキル基を持つ「低級アルキルチオ」基である。そのような低級アルキルチオ基の例は、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、ブチルチオおよびヘキシリチオである。

40

【0043】

用語「アルキルチオアルキル」は、二価硫黄原子を介して炭素原子数1~約10のアルキル基に結合したアルキルチオ基を含有する基である。より好ましいアルキルチオアルキル基は、炭素原子数1~6のアルキル基を持つ「低級アルキルチオアルキル」基である。そのような低級アルキルチオアルキル基の例として、メチルチオメチル、メチルチオエチル、エチルチオエチル、およびエチルチオプロピルが挙げられる。

【0044】

50

用語「アルキルスルフィニル」は、二価の-S(=O)-基に結合した炭素原子数1~10の直鎖または分枝鎖アルキル基を含有する基である。より好ましいアルキルスルフィニル基は、炭素原子数1~6のアルキル基を持つ「低級アルキルスルフィニル」基である。そのような低級アルキルスルフィニル基の例として、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、ブチルスルフィニルおよびヘキシルスルフィニルが挙げられる。

【0045】

用語「アミノアルキル」は、1以上のアミノ基で置換されたアルキル基である。より好ましいのは、炭素原子数1~6の「低級アミノアルキル」基である。そのような基の例として、アミノメチル、アミノエチルなどが挙げられる。

【0046】

用語「アミノカルボニル」は、式-C(=O)NH₂のアミド基である。

【0047】

用語「カルボニル」は、単独で用いられるか、「アルコキシカルボニル」のように、他の用語と共に用いられるかに関わらず、-(C=O)-である。

【0048】

用語「アリール」は、単独で、または組み合わされて、1個、2個または3個の環を含有する炭素環式芳香族系であり、それらの環は互いにペンドント的に結合していてもよいし、縮合していてもよく、それらの環のうち少なくとも1個は芳香環である。用語「アリール」には、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、インダンおよびビフェニルなどの芳香族基が含まれる。アリール部分は、置換可能な位置が、アルキル、アルコキシアルキル、アルキルアミノアルキル、カルボキシアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、アミノカルボニルアルキル、アルコキシ、アラルコキシ、ヒドロキシル、アミノ、ハロ、ニトロ、アルキルアミノ、アシル、シアノ、カルボキシ、アミノカルボニル、アルコキシカルボニルおよびアラルコキシカルボニ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。

【0049】

用語「ヘテロシクリル」および「ヘテロシクロ」は、1個、2個、または3個の環を持つ飽和または部分不飽和ヘテロ原子含有環状基であり、それらの環は互いにペンドント的に結合していてもよいし、縮合していてもよく、ヘテロ原子は窒素、硫黄および酸素から選択されうる。飽和ヘテロシクリル基および飽和ヘテロシクロ基の例として、1~4個の窒素原子を含有する飽和3~6員ヘテロ单環式基（例えばピロリジニル、イミダゾリジニル、ビペリジノ、ビペラジニルなど）；1~2個の酸素原子および1~3個の窒素原子を含有する飽和3~6員ヘテロ单環式基（例えばモルホリニルなど）；1~2個の硫黄原子および1~3個の窒素原子を含有する飽和3~6員ヘテロ单環式基（例えばチアゾリジニルなど）が挙げられる。部分不飽和ヘテロシクリル基および部分不飽和ヘテロシクロ基の例として、ジヒドロチオフェン、ジヒドロピラン、ジヒドロフランおよびジヒドロチアゾールが挙げられる。

【0050】

用語「ヘテロアリール」は、少なくとも1つの環が芳香環である1個、2個、または3個の環を持つ芳香族ヘテロ原子含有環状基である。ヘテロアリール基の例として、1~4個の窒素原子を含有する不飽和3~6員ヘテロ单環式基、例えばピロリル、ピロリニル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピリジル、ピリミジル、ピラジニル、ピリダジニル、トリアゾリル（例えば4H-1,2,4-トリアゾリル、1H-1,2,3-トリアゾリル、2H-1,2,3-トリアゾリルなど）、テトラゾリル（例えば1H-テトラゾリル、2H-テトラゾリルなど）など；1~5個の窒素原子を含有する不飽和縮合ヘテロシクリル基、例えばインドリル、イソインドリル、インドリジニル、ベンゾイミダゾリル、キノリル、イソキノリル、インダゾリル、ベンゾトリアゾリル、テトラゾロピリダジニル（例えばテトラゾロ[1,5-b]ピリダジニルなど）など；酸素原子を含有する不飽和3~6員ヘテロ单環式基、例えばピラニル、フリルなど；硫黄原子を含有する不飽和3~6員ヘテロ单環式基、例えばチエニルなど；1~2個の酸素原子および1~3個の窒素原子を含有する不飽和3~6員ヘテロ单環式基、例えばオキサゾリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル（例えば1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル）など。

10

20

30

40

50

リル、1,2,5-オキサジアゾリルなど)など; 1~2個の酸素原子および1~3個の窒素原子を含有する不飽和縮合ヘテロシクリル基(例えばベンゾオキサゾリル、ベンゾオキサジアゾリルなど); 1~2個の硫黄原子および1~3個の窒素原子を含有する不飽和3~6員ヘテロ単環式基、例えばチアゾリル、チアジアゾリル(例えば1,2,4-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,2,5-チアジアゾリルなど)など; 1~2個の硫黄原子および1~3個の窒素原子を含有する不飽和縮合ヘテロシクリル基(例えばベンゾチアゾリル、ベンゾチアジアゾリルなど)などが挙げられる。用語「ヘテロアリール」は、ヘテロアリール基がアリール基と縮合している基も包含する。そのような縮合二環式基の例として、ベンゾフラン、ベンゾチオフェンなどが挙げられる。前記ヘテロシクリル基は、置換可能な位置が、アルキル、ヒドロキシル、ハロ、アルコキシ、オキソ、アミノおよびアルキルアミノ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。

10

【0051】

用語「ヘテロシクリルアルキル」および「ヘテロシクロアルキル」は、ピロリジニルメチルなどの飽和および部分不飽和ヘテロシクリル置換アルキル基、ならびにピリジルメチル、キノリルメチル、チエニルメチル、フリルエチル、およびキノリルエチルなどのヘテロアリール置換アルキル基である。前記ヘテロアラルキル中のヘテロアリールは、ハロ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキルおよびハロアルコキシでさらに置換されていてもよい。

20

【0052】

用語「アシル」は、有機酸からヒドロキシルを除去した後の残基によって与えられる基である。そのようなアシル基の例として、アルカノイル基およびアロイル基が挙げられる。

【0053】

用語「アルカノイル」または「アルキルカルボニル」は、カルボニル基に結合した、本明細書に定義するアルキル基である。そのようなアルカノイル基の例として、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、ピバロイル、ヘキサノイル、およびトリフルオロアセチルが挙げられる。

30

【0054】

用語「アリールカルボニル」(「アロイル」ともいう)および「アラルキルカルボニル」には、カルボニル基に結合した、本明細書に定義するアリール基またはアラルキル基を持つ基が包含される。そのような基の例として、置換または無置換フェニルカルボニル、ナフトイル、およびベンジルカルボニルが挙げられる。前記アロイル基およびアラルキルカルボニル基中のアリールは、さらに置換されていてもよい。

【0055】

用語「アラルコキシ」は、酸素原子を介して他の基に結合した、本明細書に定義するアラルキル基である。

【0056】

用語「アラルコキシアルキル」は、酸素原子を介してアルキル基に結合した、本明細書に定義するアラルコキシ基である。

40

【0057】

用語「アラルキル」および「アリールアルキル」は、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、およびジフェニルエチルなどのアリール置換アルキル基である。前記アラルキル中のアリールは、ハロ、アルキル、アルコキシ、ハルコアルキル(halcoalkyl)およびハロアルコキシでさらに置換されていてもよい。用語ベンジルとフェニルメチルは可換である。

【0058】

用語「アラルキルアミノ」は、アミノ窒素原子を介して他の基に結合した、本明細書に定義するアラルキル基である。用語「N-アリールアミノアルキル」および「N-アリール-N-アルキル-アミノアルキル」は、それぞれ1個のアリール基または1個のアリール基と1個のアルキル基で置換されているアミノ基であって、そのアミノ基がアルキル基に結合して

50

いるものである。そのような基の例として、N-フェニルアミノメチルおよびN-フェニル-N-メチルアミノメチルが挙げられる。

【0059】

用語「アラルキルチオ」は、硫黄原子に結合したアラルキル基である。

【0060】

用語「アラルキルチオアルキル」は、硫黄原子を介してアルキル基に結合したアラルキルチオ基である。

【0061】

用語「アリールアミノ」は、1個または2個のアリール基で置換されているアミノ基である。そのようなアリールアミノ基の一例はN-フェニルアミノである。「アリールアミノ」基はその基のアリール環部分がさらに置換されていてもよい。

10

【0062】

用語「アリールオキシアルキル」は、二価酸素原子を介してアルキル基に結合したアリール基を持つ基である。

【0063】

用語「アリールチオアルキル」は、二価硫黄原子を介してアルキル基に結合したアリール基を持つ基である。

【0064】

用語「スルホニル」は、単独で用いられるか、アルキルスルホニルのように、他の用語につなげて用いられるかに関わらず、二価の-SO₂-基である。

20

【0065】

用語「アルキルスルホニル」は、スルホニル基に結合したアルキル基（アルキルは上記と同意義である）である。より好ましいアルキルスルホニル基は、炭素原子数1~6の「低級アルキルスルホニル」基である。そのような低級アルキルスルホニル基の例として、メチルスルホニル、エチルスルホニルおよびプロピルスルホニルが挙げられる。「アルキルスルホニル」基は、1以上のハロ原子、例えばフルオロ、クロロまたはブロモでさらに置換されて、ハロアルキルスルホニル基になっていてもよい。

【0066】

用語「スルファミル」「アミノスルホニル」および「スルホンアミジル」は、-SO₂NH₂である。

30

【0067】

「薬学的に許容できる」という用語は、本明細書では、被修飾名詞が薬学的製品での使用に適することを表すために、形容詞的に用いられる。すなわち「薬学的に許容できる」材料は、必ずしもそれ自体が分離可能な治療上の利益を与えるわけではないが、比較的安全かつ/または無毒性である。薬学的に許容できる陽イオンには、金属イオンおよび有機イオンが含まれる。より好ましい金属イオンには、例えば、適切なアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩および他の生理学的に許容できる金属イオンが含まれるが、これらに限定されるわけではない。例示的なイオンとして、それぞれ通常の原子価を持つ、アルミニウム、カルシウム、リチウム、マグネシウム、カリウム、ナトリウムおよび亜鉛が挙げられる。好ましい有機イオンとして、トリメチルアミン、ジエチルアミン、N,N'-ジベンジルエチレンジアミン、クロロプロカイン、コリン、ジエタノールアミン、エチレンジアミン、メグルミン（N-メチルグルカミン）およびプロカインなどを含む、プロトン化された3級アミンおよび4級アンモニウム陽イオンが挙げられる。例示的な薬学的に許容できる酸として、例えば塩酸、臭化水素酸、リン酸、硫酸、メタンスルホン酸、酢酸、ギ酸、酒石酸、マレイン酸、リンゴ酸、クエン酸、イソクエン酸、コハク酸、乳酸、グルコン酸、グルクロン酸、ピルビン酸、オキサロ酢酸、フマル酸、プロピオン酸、アスパラギン酸、グルタミン酸、安息香酸などが挙げられるが、これらに限定されるわけではない。

40

【0068】

用語「プロドラッグ」は、代謝過程または簡単な化学過程によって対象の体内で治療化合物に変換されうる化学化合物を指す。

50

【0069】

処置または予防に関する「対象」という用語には、処置を必要とする任意のヒト対象または動物対象が包含される。対象は家畜種、実験動物種、動物園動物または伴侶動物であることができる。ある実施形態では、対象が哺乳動物である。もう一つの実施形態では、その哺乳動物がヒトである。

【0070】

用語「PBS」は、リン酸緩衝食塩水を意味する。

【0071】

用語「HEPES」は、N-2-ヒドロキシエチルピペラジン-N'-2-エタンスルホン酸を意味する。

10

【0072】

用語「BSA」は、ウシ血清アルブミンを意味する。

【0073】

用語「STI」は、ダイズトリプシンインヒビターを意味する。

【0074】

用語「ペファブロック（Pefabloc）」は、(4-(2-アミノエチル)ベンゼンスルホニルフルオリド・HCl塩を意味する。

【0075】

用語「ホスホラミドン」は、N-*-L*-ラムノピラノシリオキシ(ヒドロキシホスフィニル)-L-ロイシル-L-トリプトファンを意味する。

20

【0076】

用語「FCC」は、フラッシュカラムクロマトグラフィーを意味する。

【0077】

用語「K_i」は、阻害速度定数（inhibitory rate constant）を意味する。

【0078】

用語「FLIPR」は、蛍光イメージングプレートリーダーを意味する。

【0079】

用語「HEK293」は、ヒト胎児腎臓293細胞株を意味する。

【0080】

用語「Boc」は、*tert*-ブトキシカルボニルを意味する。

30

【0081】

用語「DIC」は、ジイソプロピルカルボジイミドを意味する。

【0082】

用語「DCM」は、ジクロロメタンを意味する。

【0083】

用語「DBU」は、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エンを意味する。

【0084】

用語「ホスゲン」は、COCl₂を意味する。

【0085】

用語「DCE」は、ジクロロエタンを意味する。

40

【0086】

用語「DMF」は、ジメチルホルムアミドを意味する。

【0087】

用語「EtOAc」は、酢酸エチルを意味する。

【0088】

用語「HOEt」は、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物を意味する。

【0089】

用語「MeOH」は、メタノールを意味する。

【0090】

用語「TFA」は、トリフルオロ酢酸を意味する。

50

【0091】

本発明で使用されるMCH受容体アンタゴニストは、互変異性体型、幾何異性体型または立体異性体型として存在しうる。本発明では、シス-およびトランス-幾何異性体、E-およびZ-幾何異性体、R-およびS-エナンチオマー、ジアステレオマー、d-およびl-異性体、それらのラセミ混合物およびそれらの他の混合物を含めて、そのような化合物の全てが予期される。そのような互変異性体型、幾何異性体型または立体異性体型の薬学的に許容できる塩も、本発明に包含される。本明細書で使用する用語「シス」および「トランス」は、幾何異性の一形態であって、二重結合で連結されていてそれぞれ水素およびもう一つの基で置換されている2つの炭素原子が、それぞれ二重結合の同じ側に水素原子を持つもの（「シス」）または二重結合の反対側に水素原子を持つもの（「トランス」）を表す。本明細書に記載する化合物の一部はアルケニル基を含有し、それらは、シスおよびトランス幾何異性型または「E」および「Z」幾何異性型の両方を包含するものとする。さらに、本明細書に記載する化合物の一部は1以上の立体中心を含有し、それらは、存在する各立体中心についてR型、S型、およびR型とS型の混合物を包含するものとする。

10

20

30

40

50

【0092】

本発明で使用されるMCH受容体アンタゴニストは、遊離塩基の形態をとるか、その薬学的に許容できる酸付加塩の形態をとることができ。用語「薬学的に許容できる塩」は、アルカリ金属塩を形成させるため、および遊離酸または遊離塩基の付加塩を形成させるために、よく用いられる塩である。塩の性質は、それが薬学的に許容できる限り、様々であることができる。本方法で用いられる化合物の好適な薬学的に許容できる酸付加塩は、無機酸または有機酸から製造することができる。そのような無機酸の例は、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硝酸、炭酸、硫酸およびリン酸である。適切な有機酸は、脂肪族、脂環式、芳香族、アリール脂肪族(araliphatic)、複素環式のカルボン酸類およびスルホン酸類である有機酸から選択することができ、その例は、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、コハク酸、グリコール酸、グルコン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、アスコルビン酸、グルクロン酸、マレイン酸、フマル酸、ピルビン酸、アスパラギン酸、グルタミン酸、安息香酸、アントラニル酸、メシリ酸、4-ヒドロキシ安息香酸、フェニル酢酸、マンデル酸、エンポン酸(パモ酸)、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、パントテン酸、2-ヒドロキシエタンスルホン酸、トルエンスルホン酸、スルファニル酸、シクロヘキシルアミノスルホン酸、ステアリン酸、アルギン酸、ヒドロキシ酪酸、サリチル酸、ガラクタル酸およびガラクツロン酸である。本方法で使用される化合物の好適な薬学的に許容できる塩基付加塩には、アルミニウム、カルシウム、リチウム、マグネシウム、カリウム、ナトリウムおよび亜鉛から作られる金属塩、またはN,N'-ジベンジルエチレンジアミン、クロロプロカイン、コリン、ジエタノールアミン、エチレンジアミン、メグルミン(N-メチルグルカミン)、およびプロカインから作られる有機塩が包含される。これらの塩はいずれも、対応する化合物から従来の手段により、例えば適切な酸または塩基を本明細書に記載する任意の式の化合物と反応させることなどによって、製造することができる。

【0093】

本発明の実施に役立つMCH受容体アンタゴニストは、薬学的組成物に製剤化し、治療有效量を送達する任意の手段によって、投与することができる。そのような組成物は、従来の薬学的に許容できる無毒性の担体、佐剤、およびビヒクリを要望に応じて含有する投与単位製剤として、経口投与、非経口投与、吸入スプレーによる投与、直腸投与、皮内投与、経皮投与、または局所投与によって投与することができる。局所投与は、経皮貼付剤またはイオントフォレシス装置などの経皮投与の使用を伴ってもよい。本明細書で使用する非経口という用語には、皮下、静脈内、筋肉内、もしくは胸骨内注射、または注入技術を包含する。薬物の製剤化は、例えば、Hoover「Remington's Pharmaceutical Sciences」(1975)およびLberman & Lachman編「Pharmaceutical Dosage Forms」(1980)などで議論されている。

【0094】

注射可能剤、例えば滅菌された注射可能な水性または油性懸濁剤は、既知の技術に従い、適切な分散剤または湿潤剤および懸濁化剤を使って製剤化することができる。滅菌注射可能剤は、無毒性の非経口的に許容できる希釈剤または溶媒中の滅菌注射可能溶液または懸濁液であることもできる。使用可能な許容できるビヒクルおよび溶媒には、水、リソゲル液、等張食塩水などがある。また、滅菌固定油も、溶媒または懸濁媒として、従来どおり使用される。この目的には、合成モノ-またはジ-グリセリドを含む任意の無刺激性固定油を使用することができる。また、注射剤の製造には、オレイン酸などの脂肪酸も有用である。ジメチルアセトアミド、イオン性洗剤および非イオン性洗剤を含む界面活性剤、ならびにポリエチレングリコールを使用することができる。上に議論したような溶媒および湿潤剤の混合物も有用である。

10

【0095】

本明細書で議論する化合物の直腸投与用の坐剤は、活性剤を、常温では固体であるが、直腸温度では液体になり、したがって直腸内で融解して薬物を放出するような適切な非刺激性賦形剤、例えばカカオ脂、合成モノ-、ジ-、もしくはトリ-グリセリド、脂肪酸、またはポリエチレングリコールなどと混合することによって、製造することができる。

【0096】

経口投与用の固形剤形としては、カプセル剤、錠剤、丸剤、散剤、および顆粒剤を挙げることができる。そのような固形剤形では、通常、化合物が、表示された投与経路に適した1以上の佐剤と混合される。経口投与の場合は、化合物を、ラクトース、ショ糖、デンプン粉末、アルカン酸のセルロースエステル、セルロースアルキルエステル、タルク、ステアリン酸、ステアリン酸マグネシム、酸化マグネシウム、リン酸および硫酸のナトリウム塩およびカルシウム塩、ゼラチン、アラビアゴム、アルギン酸ナトリウム、ポリビニルピロリドン、および/またはポリビニルアルコールと混合した後、都合よく投与できるように錠剤化またはカプセル化することができる。そのようなカプセル剤および錠剤は、ヒドロキシプロピルメチルセルロース中の活性化合物の分散液として提供することができるよう、制御放出製剤を含有することができる。カプセル剤、錠剤、および丸剤の場合、剤形は、クエン酸ナトリウム、またはマグネシウムもしくはカルシウムの炭酸塩もしくは重炭酸塩などの緩衝剤も含むことができる。さらに、腸溶性コーティングを持つ錠剤および丸剤も製造することができる。

20

【0097】

治療目的の場合、非経口投与用製剤は、水性または非水性の等張滅菌注射溶液剤または懸濁剤の形態をとることができる。これらの溶液剤および懸濁剤は、経口投与用製剤での使用に関して言及した担体または希釈剤の1以上を含む滅菌粉末および滅菌顆粒から製造することができる。化合物は、水、ポリエチレングリコール、プロピレングリコール、エタノール、トウモロコシ油、綿実油、ラッカセイ油、ゴマ油、ベンジルアルコール、塩化ナトリウム、および/または種々の緩衝液に溶解することができる。他の佐剤および投与様式は、薬学分野では周知である。

30

【0098】

経口投与用の液体剤形としては、当技術分野でよく使用される水などの不活性希釈剤を含有する薬学的に許容できる乳剤、溶液剤、懸濁剤、シロップ剤、およびエリキシル剤を挙げることができる。そのような組成物は、湿潤剤、乳化剤および懸濁化剤、ならびに甘味剤、着香剤、および芳香剤などの佐剤も含むことができる。

40

【0099】

MCH受容体アンタゴニストの一回量を作るために担体材料と混合することができる活性成分の量は、患者および個々の投与様式に依存して変動するだろう。一般に、薬学的組成物は、約1～約250mgの範囲、より典型的には約10～約200mgの範囲、さらに典型的には約25～約150mgの範囲のMCH受容体アンタゴニストを含有しうる。約0.01～約80mg/kg体重、より典型的には約0.5～約50mg/kg体重、さらに典型的には約1～約25mg/kg体重の1日量が、適切でありうる。1日量は1日あたり1回～約4回に分けて投与することができる。

【0100】

50

MCH受容体アンタゴニストは、処置される障害または状態の処置または管理において、治療的に有効になるような量で投与される。各剤形の個々の用量に含まれる活性成分の量それ自体が有効量を構成する必要はないことは理解されるだろう。というのは、個々の用量をいくつか投与することによって、必要な有効量に到達することができるからである。投与されるべき活性なMCH受容体アンタゴニストの量が、処置対象の年齢、性別および体重、疾患のタイプ、または処置すべき症候、個々の投与方法および投与スケジュール、ならびに同時投与される他のMCH受容体アンタゴニストがあるとすれば、何を同時投与するかに応じて、変動しうることは、当業者には理解されるだろう。したがって個々の患者に対する投与量は、典型的な投与量範囲より多い場合も、少ない場合もありうる。一般的に言えば、MCH受容体アンタゴニストは、処置される障害または状態の処置、予防または管理に有効であることが知られている任意の量で使用することができる。投薬は1日あたり1回でも複数回でもよく、1日あたりの投薬数および投薬間隔は、患者の個々の必要に応じて変動する。したがって、投与量、投与方法および投与時間を含む処置の最適化は、熟練した医師が患者を個別に注意深く監視することによって決定するのが最善である。また、Goodman & Goldman「The Pharmacological Basis of Therapeutics」第9版(1996)App. II, 1707~1711頁およびGoodman & Goldman「The Pharmacological Basis of Therapeutics」第10版(2001)App. II, 475~493頁を指針にして、投与量を決定することもできることは、当業者に理解されるだろう。

10

20

30

40

50

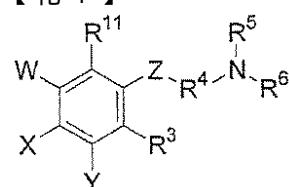
【発明を実施するための最良の形態】

【0101】

好みしい実施形態の説明

本発明の一実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の構造を持つ式Iの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグである：

【化1】



I

【0102】

[式中、

【0103】

Wは、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

【0104】

Xは、-OR¹、-NR¹R¹⁰、および-SR¹からなる群より選択される；

【0105】

Yは、水素、-N(R⁷)C(O)NR²R⁸、-N(R⁷)C(O)OR²、-N(R⁷)C(O)R²、-N(R⁷)SO₂R²、および-NR²R⁷からなる群より選択される；

【0106】

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)-、-CH₂N(R⁹)-、および-N(R¹²)C(O)N(R⁹)-からなる群より選択される；

【0107】

R¹は、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアリールアルキルからなる群より選択され、R¹は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0108】

R^2 は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、アリールシクロアルキル、およびヘテロアリールアルキルからなる群より選択されるか、 R^2 は、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される不飽和縮合複素環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0109】

R^3 は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

10

【0110】

R^4 は、結合、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、およびヘテロアリールアルキルからなる群より選択されるか、 R^4 は、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、アルコキシカルボニル、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0111】

R^5 は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

20

【0112】

R^6 は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

30

【0113】

R^7 は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

【0114】

R^8 は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらの結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる；

40

【0115】

R^9 は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0116】

R^{10} は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

【0117】

50

R^{11} は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；そして

【0118】

R^{12} は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される】。

【0119】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式1の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中

10

【0120】

Wは、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

【0121】

Xは、 $-OR^1$ 、 $-NR^1R^{10}$ 、および $-SR^1$ からなる群より選択される；

【0122】

Yは、水素、 $-N(R^7)C(O)NR^2R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)OR^2$ 、 $-N(R^7)C(O)R^2$ 、 $-N(R^7)SO_2R^2$ 、および $-NR^2R^7$ からなる群より選択される；

20

【0123】

Zは、 $-CH=CH-$ 、 $-CH_2N(R^9)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)N(R^9)-$ 、および $-N(R^{12})C(O)N(R^9)-$ からなる群より選択される；

【0124】

R^1 は、低級アルキル、低級シクロアルキル、低級シクロアルキルアルキル、アリール、低級アラルキル、ヘテロアリール、および低級ヘテロアリールアルキルからなる群より選択され、 R^1 は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてよい；

30

【0125】

R^2 は、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、低級アリールシクロアルキル、および低級ヘテロアリールアルキルからなる群より選択されるか、 R^2 は、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される不飽和縮合複素環は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてよい；

【0126】

R^3 は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

40

【0127】

R^4 は、結合、低級アルキル、低級アルケニル、低級アルキニル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、および低級ヘテロアリールアルキルからなる群より選択されるか、 R^4 は、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、低級アルコキシカルボニル、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてよい；

50

【0128】

R^5 は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0129】

R^6 は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

10

【0130】

R^7 は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

【0131】

R^8 は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる；

20

【0132】

R^9 は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

30

【0133】

R^{10} は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

【0134】

R^{11} は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；そして

40

【0135】

R^{12} は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される。

【0136】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式1の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

【0137】

Wは、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、

50

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、クロロ、ブロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択される；

【0138】

Xは、-OR¹、-NR¹R¹⁰、および-SR¹からなる群より選択される；

【0139】

Yは、水素、-N(R⁷)C(O)NR²R⁸、-N(R⁷)C(O)OR²、-N(R⁷)C(O)R²、-N(R⁷)SO₂R²、および-NR²R⁷からなる群より選択される；

【0140】

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)-、-C(O)N(R⁹)-、および-N(R¹²)C(O)N(R⁹)-からなる群より選択される；

【0141】

R¹は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル(cyclobutylpennyl)、シクロペンチルメチル、シクロペンチルエチル、シクロペンチルプロピル、シクロペンチルブチル、シクロペンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリルからなる群より選択され、R¹は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0142】

R²は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルブチル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル(cyclobutylpennyl)、シクロペンチルメチル、シクロペンチルエチル、シクロペンチルプロピル、シクロ

10

20

30

40

50

ペンチルブチル、シクロペンチルペンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルペンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルペンテニル、フェニルシクロプロピル、フェニルシクロブチル、フェニルシクロベンチル、フェニルシクロヘキシル、ビフェニルシクロプロピル、ビフェニルシクロブチル、ビフェニルシクロベンチル、ビフェニルシクロヘキシル、ナフチルシクロプロピル、ナフチルシクロブチル、ナフチルシクロベンチル、ナフチルシクロヘキシルからなる群より選択されるか、 R^2 は、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ヘキサヒドロイソインドリル、テトラヒドロイソインドリル、ジヒドロイソインドリル、イソインドリニル、ヘキサヒドロインドリル、テトラヒドロインドリル、ジヒドロインドリル、インドリニル、オクタヒドロキノリニル、ヘキサヒドロキノリニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、およびキノリニルからなる群より選択される環を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される環は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0143】

R^3 は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択される；

【0144】

R^4 は、結合、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、エテニル、ブロペニル、アリル、ブテニル、ペンテニル、アセチレン、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルブロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル（cyclobutylpenyyl）、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルペンテニルからなる群より選択されるか、 R^4 は、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環

10

20

30

40

50

を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0145】

R^5 は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

【0146】

R^6 は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

【0147】

R^7 は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキ

10

20

30

40

50

シヘキシリ、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシリル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシリ、およびシアノからなる群より選択される；

【0148】

10

R^8 は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシリ、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシリル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシリ、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、イソインドリニル環を形成することができる；

【0149】

20

R^9 は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシリ、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシリル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシリ、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

【0150】

30

R^{10} は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒ

40

50

ドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシペンチル、ヒドロキシヘキシリ、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシリル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシリ、およびシアノからなる群より選択される；

10

【0151】

R^{11} は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、ブロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシリ、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシリル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシリ、およびシアノからなる群より選択される；そして

20

【0152】

R^{12} は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、ブロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシリ、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシリル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシリ、およびシアノからなる群より選択される。

30

【0153】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式1の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

40

【0154】

W は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

50

【0155】

Xは、-OR¹である；

【0156】

Yは、水素、-N(R⁷)C(O)NR²R⁸、-N(R⁷)C(O)OR²、-N(R⁷)C(O)R²、-N(R⁷)SO₂R²、および-NR²R⁷からなる群より選択される；

【0157】

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)-、-C(O)N(R⁹)-、および-N(R¹²)C(O)N(R⁹)-からなる群より選択される；

【0158】

R¹は、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアリールアルキルからなる群より選択され、R¹は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい； 10

【0159】

R²は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、アリールシクロアルキル、およびヘテロアリールアルキルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される不飽和縮合複素環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい； 20

【0160】

R³は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

【0161】

R⁴は、結合、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、およびヘテロアリールアルキルからなる群より選択されるか、R⁴は、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、R⁴、またはR⁹と共に形成される環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、アルコキシカルボニル、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい； 30

【0162】

R⁵は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁵は、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0163】

R⁶は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁶は、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる； 40

【0164】

R⁷は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

【0165】

R⁸は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、 50

アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁸は、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる；

【0166】

R⁹は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁹は、R⁴およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0167】

R¹⁰は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

【0168】

R¹¹は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；そして

【0169】

R¹²は、水素、ヒドロキシ、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ハロ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；そして

【0170】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式Iの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる；式中、

【0171】

Wは、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

【0172】

Xは、-OR¹である；

【0173】

Yは、水素、-N(R⁷)C(O)NR²R⁸、-N(R⁷)C(O)OR²、-N(R⁷)C(O)R²、-N(R⁷)SO₂R²、および-NR²R⁷からなる群より選択される；

【0174】

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)-、-C(O)N(R⁹)-、および-N(R¹²)C(O)N(R⁹)-からなる群より選択される；

【0175】

R¹は、低級アルキル、低級シクロアルキル、低級シクロアルキルアルキル、アリール、低級アラルキル、ヘテロアリール、および低級ヘテロアリールアルキルからなる群より選択され、R¹は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシリ、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてよい；

【0176】

R²は、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、低級アリールシクロアルキル、および低級ヘテロアリールアルキルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される不飽和縮合複素環は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシリ、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以

10

20

30

40

50

上の置換基で置換されていてもよい；

【0177】

R^3 は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

【0178】

R^4 は、結合、低級アルキル、低級アルケニル、低級アルキニル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、および低級ヘテロアリールアルキルからなる群より選択されるか、 R^4 は、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、低級アルコキシカルボニル、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

10

【0179】

R^5 は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

20

【0180】

R^6 は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

20

【0181】

R^7 は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

30

【0182】

R^8 は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる；

30

【0183】

R^9 は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

40

【0184】

R^{10} は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシル、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；

【0185】

R^{11} は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラ

50

ルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される；そして

【0186】

R^{12} は、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、ハロ、低級アルコキシ、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、アリールオキシ、カルボキシリ、低級カルボキシアルキル、およびシアノからなる群より選択される。

【0187】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式1の化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

【0188】

Wは、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、クロロ、ブロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシリ、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシリ、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシリ、およびシアノからなる群より選択される；

【0189】

Xは、 $-OR^1$ である；

【0190】

Yは、水素、 $-N(R^7)C(O)NR^2R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)OR^2$ 、 $-N(R^7)C(O)R^2$ 、 $-N(R^7)SO_2R^2$ 、および $-N(R^2)R^7$ からなる群より選択される；

【0191】

Zは、 $-CH=CH-$ 、 $-CH_2N(R^9)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)N(R^9)-$ 、および $-N(R^{12})C(O)N(R^9)-$ からなる群より選択される；

【0192】

R^1 は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリ、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロヘキシリメチル、シクロヘキシリエチル、シクロヘキシリブチル、シクロヘキシリベンチル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリルからなる群より選択され、 R^1 は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ

10

20

30

40

50

、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0193】

R^2 は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル (*cyclobutylpenyl*)、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルベンテニル、フェニルシクロプロピル、フェニルシクロブチル、フェニルシクロベンチル、フェニルシクロヘキシル、ビフェニルシクロプロピル、ビフェニルシクロブチル、ビフェニルシクロベンチル、ビフェニルシクロヘキシル、ナフチルシクロプロピル、ナフチルシクロブチル、ナフチルシクロベンチル、ナフチルシクロヘキシルからなる群より選択されるか、 R^2 は、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ヘキサヒドロイソインドリル、テトラヒドロイソインドリル、ジヒドロイソインドリル、イソインドリニル、ヘキサヒドロインドリル、テトラヒドロインドリル、ジヒドロインドリル、インドリニル、オクタヒドロキノリニル、ヘキサヒドロキノリニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、およびキノリニルからなる群より選択される環を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される環は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0194】

R^3 は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択される；

【0195】

R^4 は、結合、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、エテニル、プロペニル、アリル、ブテニル、ペンテニル、アセチレン、プロピニル、ブチニル、ペン

10

20

30

40

50

チニル、ヘキシニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリ
 、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル (cyclobutylpennyl)、シクロペンチルメチル、シクロペンチルエチル、シクロペンチルプロピル、シクロペンチルブチル、シクロペンチルベンチル、シクロヘキシリメチル、シクロヘキシリエチル、シクロヘキシリプロピル、シクロヘキシリブチル、シクロヘキシリベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルペンテニルからなる群より選択されるか、R⁴は、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ、R⁴、またはR⁹と共に形成される環は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、ヘキシリオキシカルボニル、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【 0 1 9 6 】

R^5 は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、ブロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシペンチル、ヒドロキシヘキシリ、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシペンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシペンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシペンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシペンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシリル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシペンチル、カルボキシヘキシリ、およびシアノからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピベリジニル環を形成することができる；

【 0 1 9 7 】

R^6 は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、ブロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシペンチル、ヒドロキシヘキシリ、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシペンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシペンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピ

ル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁶は、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

【0198】

R⁷は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択される；

【0199】

R⁸は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁸は、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、イソインドリニル環を形成することができる；

【0200】

R⁹は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択される；

10

20

30

40

50

ポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択されるか、R⁹は、R⁴およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

【 0 2 0 1 】

R¹⁰は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ
、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチ
ル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメ
チル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、ブロモ、フルオロ、メトキシ、エト
キシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒ
ドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシペンチル、ヒドロ
キシヘキシリ、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、
メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチ
ル、エトキシペンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、ブ
ロポキシブチル、プロポキシペンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロ
ピル、ブトキシブチル、ブトキシペンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペ
ントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシペンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ
、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシリル、カルボキシメチル
、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシペンチル、カ
ルボキシヘキシリ、およびシアノからなる群より選択される；

【 0 2 0 2 】

R^1 は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、ブロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシペンチル、ヒドロキシヘキシリル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシペンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシペンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシペンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシペンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシリル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシペンチル、カルボキシヘキシリル、およびシアノからなる群より選択される；そして

【 0 2 0 3 】

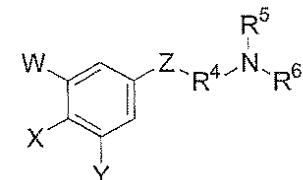
R^1 は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシリ
、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチ
ル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメ
チル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、ブロモ、フルオロ、メトキシ、エト
キシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒ
ドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシペンチル、ヒドロ
キシヘキシリ、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、
メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチ
ル、エトキシペンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、ブ

ロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択される。

【0204】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、式IIによって表される式Iの化合物のサブクラス：

【化2】



II

【0205】

[式中、

【0206】

Wは、水素、ヒドロキシ、アルキル、およびアルコキシからなる群より選択される；

【0207】

Xは、-OR¹、-NR¹R¹⁰、および-SR¹からなる群より選択される；

【0208】

Yは、水素、-N(R⁷)C(O)NR²R⁸、-N(R⁷)C(O)OR²、-N(R⁷)C(O)R²、-N(R⁷)SO₂R²、および-NR²R⁷からなる群より選択される；

【0209】

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)-、-C(O)N(R⁹)-、および-N(R¹²)C(O)N(R⁹)-からなる群より選択される；

【0210】

R¹は、アルキル、シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、R¹は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0211】

R²は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、およびアリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される不飽和縮合複素環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0212】

R⁴は、結合、アルキル、アルケニル、およびシクロアルキルからなる群より選択されるか、R⁴は、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、R⁴、またはR⁹と共に形成される環は、アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0213】

R⁵は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアリルからなる群より選択されるか、R⁵は、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0214】

10

20

30

40

50

R^6 は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0215】

R^7 は、水素、アルキル、およびアリールからなる群より選択される；

【0216】

R^8 は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる；

10

【0217】

R^9 は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0218】

R^{10} は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択される；そして

【0219】

R^{12} は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択される】

20

【0220】

またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグから選択される。

【0221】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式IIの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

【0222】

Wは、水素、ヒドロキシ、低級アルキル、および低級アルコキシからなる群より選択される；

30

【0223】

Xは、-OR¹、-NR¹R¹⁰、および-SR¹からなる群より選択される；

【0224】

Yは、水素、-N(R⁷)C(O)NR²R⁸、-N(R⁷)C(O)OR²、-N(R⁷)C(O)R²、-N(R⁷)SO₂R²、および-NR²R⁷からなる群より選択される；

【0225】

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)-、-C(O)N(R⁹)-、および-N(R¹²)C(O)N(R⁹)-からなる群より選択される；

【0226】

R^1 は、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^1 は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

40

【0227】

R^2 は、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、および低級アリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^2 は、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される不飽和縮合複素環は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていても

50

よい；

【0228】

R^4 は、結合、低級アルキル、低級アルケニル、および低級シクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^4 は、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環は、低級アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されてもよい；

【0229】

R^5 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0230】

R^6 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0231】

R^7 は、水素、低級アルキル、およびアリールからなる群より選択される；

【0232】

R^8 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる；

【0233】

R^9 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0234】

R^{10} は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択される；そして

【0235】

R^{12} は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択される。

【0236】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式IIの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

【0237】

W は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、およびヘキシルオキシからなる群より選択される；

【0238】

X は、 $-OR^1$ 、 $-NR^1R^{10}$ 、および $-SR^1$ からなる群より選択される；

【0239】

Y は、水素、 $-N(R^7)C(O)NR^2R^8$ 、 $-N(R^7)C(O)OR^2$ 、 $-N(R^7)C(O)R^2$ 、 $-N(R^7)SO_2R^2$ 、および $-NR^2R^7$ からなる群より選択される；

【0240】

Z は、 $-CH=CH-$ 、 $-CH_2N(R^9)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)N(R^9)-$ 、および $-N(R^{12})C(O)N(R^9)-$ からなる

10

20

30

40

50

群より選択される；

【0241】

R^1 は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリニアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、およびベンゾジオキソリルからなる群より選択され、 R^1 は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0242】

R^2 は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリニアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル、シクロブチルベンチル (*cyclobutylpenyl*)、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルベンテニル、フェニルシクロプロピル、フェニルシクロブチル、フェニルシクロベンチル、フェニルシクロヘキシル、ビフェニルシクロプロピル、ビフェニルシクロブチル、ビフェニルシクロベンチル、ビフェニルシクロヘキシル、ナフチルシクロプロピル、ナフチルシクロブチル、ナフチルシクロベンチル、ナフチルシクロヘキシルからなる群より選択されるか、 R^2 は、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ヘキサヒドロイソインドリル、テトラヒドロイソインドリル、ジヒドロイソインドリル、イソインドリニル、ヘキサヒドロインドリル、テトラヒドロインドリル、ジヒドロインドリル、インドリニル、オクタヒドロキノリニル、ヘキサヒドロキノリニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、およびキノリニルからなる群より選択される環を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される環は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0243】

R^3 は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロ

10

20

30

40

50

ポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択される；

【0244】

R^4 は、結合、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、エテニル、ブロペニル、アリル、ブテニル、ペンテニル、アセチレニル、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、インオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルブロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルブロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル (*cyclobutylpenyyl*)、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルブロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルベンテニルからなる群より選択されるか、 R^4 は、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0245】

R^5 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

【0246】

R^6 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

10

20

30

40

50

【0247】

R^7 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、およびビフェニルからなる群より選択される；

【0248】

R^8 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、イソインドリニル環を形成することができる；

【0249】

R^9 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

【0250】

R^{10} は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択される；そして

【0251】

R^{12} は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒ

10

20

30

40

50

ドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択される。

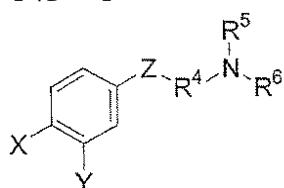
10

20

【0252】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、式IIIで表される式Iの化合物のサブクラス：

【化3】



30

III

【0253】

[式中、

【0254】

Xは、-OR¹および-SR¹からなる群より選択される；

【0255】

Yは、水素、-N(R⁷)C(O)NR²R⁸、-N(R⁷)C(O)OR²、-N(R⁷)C(O)R²、-N(R⁷)SO₂R²、および-NR²R⁷からなる群より選択される；

【0256】

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)N(R⁹)-、および-NHC(O)NR⁹-からなる群より選択される；

【0257】

R¹は、アルキル、シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、R¹は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0258】

R²は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、およびアリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される不飽和縮合複素環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

40

【0259】

R⁴は、結合、アルキル、アルケニル、およびシクロアルキルからなる群より選択されるか、R⁴は、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、R⁴、またはR⁸と共に形成される環は、アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0260】

R⁵は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシア

50

ルキルからなる群より選択されるか、R⁵は、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0261】

R⁶は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁶は、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0262】

R⁷は、水素、アルキル、およびアリールからなる群より選択される；

【0263】

R⁸は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁸は、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる；

【0264】

R⁹は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁹は、R⁴およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0265】

R¹⁰は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択される；そして

【0266】

R¹²は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択される]

【0267】

またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグから選択される。

【0268】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式IIIの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

【0269】

Xは、-OR¹および-SR¹からなる群より選択される；

【0270】

Yは、水素、-N(R⁷)C(O)NR²R⁸、-N(R⁷)C(O)OR²、-N(R⁷)C(O)R²、-N(R⁷)SO₂R²、および-NR²R⁷からなる群より選択される；

【0271】

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)N(R⁹)-、および-NHC(O)NR⁹-からなる群より選択される；

【0272】

R¹は、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、R¹は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0273】

R²は、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、および低級アリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される不飽和縮合複素環は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていても

10

20

30

40

50

よい；

【0274】

R^4 は、結合、低級アルキル、低級アルケニル、および低級シクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^4 は、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、 R^4 は、低級アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0275】

R^5 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

10

【0276】

R^6 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0277】

R^7 は、水素、低級アルキル、およびアリールからなる群より選択される；

【0278】

R^8 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる；

20

【0279】

R^9 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0280】

R^{10} は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択される；そして

30

【0281】

R^{12} は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択される。

【0282】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式IIIの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

【0283】

Xは、-OR¹および-SR¹からなる群より選択される；

40

【0284】

Yは、水素、-N(R⁷)C(O)NR²R⁸、-N(R⁷)C(O)OR²、-N(R⁷)C(O)R²、-N(R⁷)SO₂R²、および-NR²R⁷からなる群より選択される；

【0285】

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)N(R⁹)-、および-NHC(O)NR⁹-からなる群より選択される；

【0286】

R^1 は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル

50

、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、およびベンゾジオキソリルからなる群より選択され、R¹は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0287】

R²は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル(cyclobutylpenyl)、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルペンテニル、フェニルシクロプロピル、フェニルシクロブチル、フェニルシクロベンチル、フェニルシクロヘキシル、ビフェニルシクロプロピル、ビフェニルシクロブチル、ビフェニルシクロベンチル、ビフェニルシクロヘキシル、ナフチルシクロプロピル、ナフチルシクロブチル、ナフチルシクロベンチル、ナフチルシクロヘキシルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ヘキサヒドロイソインドリル、テトラヒドロイソインドリル、ジヒドロイソインドリル、イソインドリニル、ヘキサヒドロインドリル、テトラヒドロインドリル、ジヒドロインドリル、インドリニル、オクタヒドロキノリニル、ヘキサヒドロキノリニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、およびキノリニルからなる群より選択される環を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される環は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0288】

R³は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、ブロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カル

10

20

30

40

50

ボキシヘキシル、およびシアノからなる群より選択される；

【0289】

R^4 は、結合、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、エテニル、プロペニル、アリル、ブテニル、ペンテニル、アセチレニル、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル(cyclobutylpenyyl)、シクロペンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルペンテニルからなる群より選択されるか、 R^4 は、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0290】

R^5 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

【0291】

R^6 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

【0292】

R^7 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、およびビフェニルからなる群より選択される；

【0293】

R^8 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピ

10

20

30

40

50

ル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、R⁸は、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、イソインドリニル環を形成することができる；

【0294】

R⁹は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、R⁹は、R⁴およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

【0295】

R¹⁰は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択される；そして

【0296】

R¹²は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル

10

20

30

40

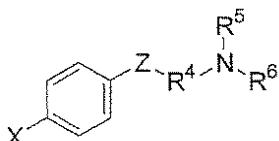
50

メチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択される。

【0297】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、式IVによって表される式Iの化合物のサブクラス：

【化4】



10

IV

【0298】

[式中、

【0299】

Xは、-OR¹および-SR¹からなる群より選択される；

20

【0300】

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)N(R⁹)-、および-NHC(O)NR⁹-からなる群より選択される；

【0301】

R¹は、アルキル、シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、R¹は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0302】

R²は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、およびアリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される不飽和縮合複素環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

30

【0303】

R⁴は、結合、アルキル、アルケニル、およびシクロアルキルからなる群より選択されるか、R⁴は、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、R⁴、またはR⁹と共に形成される環は、アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

40

【0304】

R⁵は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁵は、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0305】

R⁶は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁶は、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0306】

R⁷は、水素、アルキル、およびアリールからなる群より選択される；

【0307】

50

R^8 は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる；

【0308】

R^9 は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0309】

R^{10} は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択される；そして

【0310】

R^{12} は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択される】

【0311】

またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグから選択される。

【0312】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式IVの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

【0313】

X は、 $-OR^1$ および $-SR^1$ からなる群より選択される；

【0314】

Z は、 $-CH=CH-$ 、 $-CH_2N(R^9)-$ 、 $-C(O)N(R^9)-$ 、および $-NHC(O)NR^9-$ からなる群より選択される；

【0315】

R^1 は、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^1 は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0316】

R^2 は、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、および低級アリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^2 は、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される不飽和縮合複素環は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0317】

R^4 は、結合、低級アルキル、低級アルケニル、および低級シクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^4 は、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環は、低級アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0318】

R^5 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0319】

10

20

30

40

50

R^6 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0320】

R^7 は、水素、低級アルキル、およびアリールからなる群より選択される；

【0321】

R^8 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる；

10

【0322】

R^9 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0323】

R^{10} は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択される；そして

20

【0324】

R^{12} は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択される。

【0325】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式IVの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

【0326】

X は、 $-OR^1$ および $-SR^1$ からなる群より選択される；

30

【0327】

Z は、 $-CH=CH-$ 、 $-CH_2N(R^9)-$ 、 $-C(O)N(R^9)-$ 、および $-NHC(O)NR^9-$ からなる群より選択される；

【0328】

R^1 は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリニアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、およびベンゾジオキソリルからなる群より選択され、 R^1 は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

40

【0329】

R^2 は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリニアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニル

50

エチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル (cyclobutylpenyyl)、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシリメチル、シクロヘキシリエチル、シクロヘキシリプロピル、シクロヘキシリブチル、シクロヘキシリベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルペンテニル、フェニルシクロプロピル、フェニルシクロブチル、フェニルシクロベンチル、フェニルシクロヘキシリ、ビフェニルシクロプロピル、ビフェニルシクロブチル、ビフェニルシクロベンチル、ビフェニルシクロヘキシリ、ナフチルシクロプロピル、ナフチルシクロブチル、ナフチルシクロベンチル、ナフチルシクロヘキシリからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ヘキサヒドロイソインドリル、テトラヒドロイソインドリル、ジヒドロイソインドリル、イソインドリニル、ヘキサヒドロインドリル、テトラヒドロインドリル、ジヒドロインドリル、インドリニル、オクタヒドロキノリニル、ヘキサヒドロキノリニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、およびキノリニルからなる群より選択される環を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される環は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシリ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ベンチルオキシ、ヘキシリオキシ、カルボキシリ、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0330】

R³は、水素、ヒドロキシ、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシリ、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、クロロ、プロモ、フルオロ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ベンチルオキシ、ヘキシリオキシ、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシリ、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、カルボキシリ、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、カルボキシヘキシリ、およびシアノからなる群より選択される；

【0331】

R⁴は、結合、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシリ、エテニル、ブロペニル、アリル、ブテニル、ペンテニル、アセチレン、プロピニル、ブチニル、ベンチニル、ヘキシニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル (cyclobutylpenyyl)、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シ

10

20

30

40

50

クロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルペンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルベンテニルからなる群より選択されるか、R⁴は、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ、R⁴、またはR⁹と共に形成される環は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

10

【0332】

R⁵は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシペンチル、ブトキシブチル、ブトキシペンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシペンチルからなる群より選択されるか、R⁵は、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

20

【0333】

R⁶は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシペンチル、ブトキシブチル、ブトキシペンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシペンチルからなる群より選択されるか、R⁶は、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

30

【0334】

R⁷は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、およびビフェニルからなる群より選択される；

【0335】

R⁸は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシペンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシペンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシペンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシペンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシペンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシペンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシペンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、R⁸は、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、イソインドリニル環を形成することができる；

40

【0336】

50

R^9 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

【0337】

R^{10} は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択される；そして

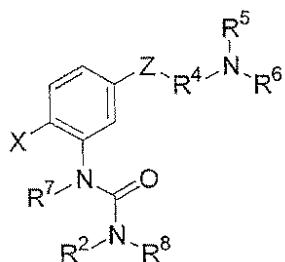
【0338】

R^{12} は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択される。

【0339】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、式Vで表される式Iの化合物のサブクラス：

【化5】



V

10

【0340】

[式中、

【0341】

Xは、-OR¹および-SR¹からなる群より選択される；

【0342】

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)N(R⁹)-、および-NHC(O)NR⁹-からなる群より選択される；

【0343】

R¹は、アルキル、シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、R¹は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

20

【0344】

R²は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、およびアリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される不飽和縮合複素環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0345】

R⁴は、結合、アルキル、アルケニル、およびシクロアルキルからなる群より選択されるか、R⁴は、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、R⁴、またはR⁹と共に形成される環は、アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

30

【0346】

R⁵は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁵は、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0347】

R⁶は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁶は、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

40

【0348】

R⁷は、水素、アルキル、およびアリールからなる群より選択される；

【0349】

R⁸は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁸は、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる；そして

【0350】

R⁹は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル

50

、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁹は、R⁴およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる】

【0351】

またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグから選択される。

【0352】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式Vの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

【0353】

Xは、-OR¹および-SR¹からなる群より選択される；

【0354】

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)N(R⁹)-、および-NHC(O)NR⁹-からなる群より選択される；

【0355】

R¹は、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、R¹は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0356】

R²は、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、および低級アリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される不飽和縮合複素環は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0357】

R⁴は、結合、低級アルキル、低級アルケニル、および低級シクロアルキルからなる群より選択されるか、R⁴は、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、R⁴、またはR⁹と共に形成される環は、低級アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0358】

R⁵は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁵は、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0359】

R⁶は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁶は、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0360】

R⁷は、水素、低級アルキル、およびアリールからなる群より選択される；

【0361】

R⁸は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁸は、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ；そして

【0362】

R⁹は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒ

10

20

30

40

50

ドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、R⁹は、R⁴およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる。

【0363】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式Vの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

【0364】

Xは、-OR¹および-SR¹からなる群より選択される；

【0365】

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)N(R⁹)-、および-NHC(O)NR⁹-からなる群より選択される；

【0366】

R¹は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、およびベンゾジオキソリルからなる群より選択され、R¹は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0367】

R²は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル(cyclobutylpenyl)、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルベンテニル、フェニルシクロプロピル、フェニルシクロブチル、フェニルシクロベンチル、フェニルシクロヘキシル、ビフェニルシクロプロピル、ビフェニルシクロブチル、ビフェニルシクロベンチル、ビフェニルシクロヘキシル、ナフチルシクロプロピル、ナフチルシクロブチル、ナフチルシクロベンチル、ナフチルシクロヘキシルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ヘキサヒドロイソインドリル、テトラヒドロイソインドリル、ジヒドロイソインドリル、イソインドリニル、ヘキサヒドロインドリル、テトラヒドロインドリル、ジヒドロインドリル、インドリニル、オクタヒドロキノリニル、ヘキサヒドロキノリニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、およびキノリニルからなる群より選択される環を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される環は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される

10

20

30

40

50

1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0368】

R^4 は、結合、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、エテニル、プロペニル、アリル、ブテニル、ペンテニル、アセチレニル、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル(cyclobutylpenyyl)、シクロペンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル、シクロヘキシルブチル、シクロヘキシルベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルペンテニルからなる群より選択されるか、 R^4 は、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0369】

R^5 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

【0370】

R^6 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

【0371】

R^7 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、およびビフェニルからなる群より選択される；

【0372】

R^8 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピ

10

20

30

40

50

ル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、R⁸は、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、イソインドリニル環を形成することができる；そして

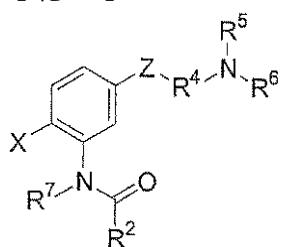
【0373】

R⁹は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、R⁹は、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、イソインドリニル環を形成することができる。

【0374】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、式VIで表される式Iの化合物のサブクラス：

【化6】



VI

【0375】

[式中、

【0376】

Xは、-OR¹および-SR¹からなる群より選択される；

【0377】

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)N(R⁹)-、および-NHC(O)NR⁹-からなる群より選択される；

【0378】

R¹は、アルキル、シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、R¹は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシル、アリールオキシ、オ

10

20

20

30

40

50

キソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0379】

R^2 は、アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、およびアリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^2 は、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される不飽和縮合複素環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、カルボキシリル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0380】

R^4 は、結合、アルキル、アルケニル、およびシクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^4 は、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環は、アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0381】

R^5 は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0382】

R^6 は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、およびアルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0383】

R^7 は、水素、アルキル、およびアリールからなる群より選択される；そして

【0384】

R^9 は、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール、アラルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、およびカルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる]

【0385】

またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグから選択される。

【0386】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式VIの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

【0387】

X は、-OR¹および-SR¹からなる群より選択される；

【0388】

Z は、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)N(R⁹)-、および-NHC(O)NR⁹-からなる群より選択される；

【0389】

R^1 は、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、およびヘテロアリールからなる群より選択され、 R^1 は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシリル、アリールオキシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0390】

R^2 は、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、および低級アリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^2 は、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される不飽和縮合複素環は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、カルボキシリル、アリールオ

10

20

30

40

50

キシ、オキソ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0391】

R^4 は、結合、低級アルキル、低級アルケニル、および低級シクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^4 は、 R^9 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、 R^4 、または R^9 と共に形成される環は、低級アルキル、ヒドロキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0392】

R^5 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0393】

R^6 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、および低級アルコキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0394】

R^7 は、水素、低級アルキル、およびアリールからなる群より選択される；

【0395】

R^8 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる；そして

【0396】

R^9 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、アリール、低級アラルキル、低級ヒドロキシアルキル、低級アルコキシアルキル、および低級カルボキシアルキルからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^4 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる。

【0397】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式VIの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

【0398】

Xは、-OR¹および-SR¹からなる群より選択される；

【0399】

Zは、-CH=CH-、-CH₂N(R⁹)-、-C(O)N(R⁹)-、および-NHC(O)NR⁹-からなる群より選択される；

【0400】

R^1 は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリニアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、およびベンゾジオキソリルからなる群より選択され、 R^1 は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0401】

R^2 は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シ

10

20

30

40

50

クロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルブチル、シクロブチルベンチル (cyclobutylpenyl) 、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシリメチル、シクロヘキシリエチル、シクロヘキシリプロピル、シクロヘキシリブチル、シクロヘキシリベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルベンテニル、フェニルシクロプロピル、フェニルシクロブチル、フェニルシクロベンチル、フェニルシクロヘキシル、ビフェニルシクロプロピル、ビフェニルシクロブチル、ビフェニルシクロベンチル、ビフェニルシクロヘキシル、ナフチルシクロプロピル、ナフチルシクロブチル、ナフチルシクロベンチル、ナフチルシクロヘキシルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ヘキサヒドロイソインドリル、テトラヒドロイソインドリル、ジヒドロイソインドリル、イソインドリニル、ヘキサヒドロインドリル、テトラヒドロインドリル、ジヒドロインドリル、インドリニル、オクタヒドロキノリニル、ヘキサヒドロキノリニル、テトラヒドロキノリニル、ジヒドロキノリニル、およびキノリニルからなる群より選択される環を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される環は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシリ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ベンチルオキシ、ヘキシリオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0402】

R⁴は、結合、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシリ、エテニル、プロペニル、アリル、ブテニル、ベンテニル、アセチレン、プロピニル、ブチニル、ベンチニル、ヘキシニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロベンチル、シクロヘキシリ、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、インドリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、オキサトリアゾリル、ジオキサゾール、テトラゾリル、ベンゾジオキソリル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルブチル、シクロプロピルベンチル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、シクロブチルプロピル、シクロブチルベンチル (cyclobutylpenyl) 、シクロベンチルメチル、シクロベンチルエチル、シクロベンチルプロピル、シクロベンチルブチル、シクロベンチルベンチル、シクロヘキシリメチル、シクロヘキシリエチル、シクロヘキシリプロピル、シクロヘキシリブチル、シクロヘキシリベンチル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルアリル、フェニルブテニル、フェニルベンテニルからなる群より選択されるか、R⁴は、R⁹およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ、R⁴、またはR⁹と共に形成される環は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ベンチル、ヘキシリ、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ベンチルオキシ、ヘキシリオキシ、カルボキシル、フェノキシ、ナフチルオキシ、テトラヒドロナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、オキソ、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、ベンチルオキシカルボニル、ヘキシリオキシカルボニル、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

10

20

30

40

50

【0403】

R^5 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロ pentachloroheptane、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全體として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

10

【0404】

R^6 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロ pentachloroheptane、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、およびペントキシベンチルからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全體として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる；

20

【0405】

R^7 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、およびビフェニルからなる群より選択される；

【0406】

R^8 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロ pentachloroheptane、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全體として、イソインドリニル環を形成することができる；そして

30

【0407】

R^9 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロ pentachloroheptane、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、フェニルエチル、ジフェニルエチル、ヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチル、ヒドロキシベンチル、ヒドロキシヘキシル、メトキシメチル、メトキシエチル、メトキシプロピル、メトキシブチル、メトキシベンチル、エトキシメチル、エトキシエチル、エトキシプロピル、エトキシブチル、エトキシベンチル、プロポキシメチル、プロポキシエチル、プロポキシプロピル、プロポキシブチル、プロポキシベンチル、ブトキシメチル、ブトキシエチル、ブトキシプロピル、ブトキシブチル、ブトキシベンチル、ペントキシメチル、ペントキシエチル、ペントキシプロピル、ペントキシブチル、ペントキシベンチル、ペントキシベンチル、カルボキシメチル、カルボキシエチル、カルボキシプロピル、カルボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、 R^9 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全體として、イソインドリニル環を形成することができる；そして

40

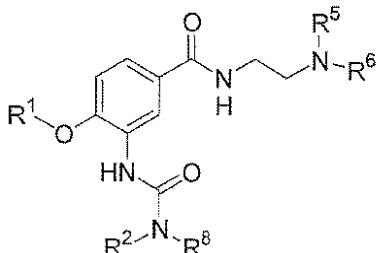
50

ボキシブチル、カルボキシベンチル、およびカルボキシヘキシルからなる群より選択されるか、R⁹は、R⁴およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができる。

【0408】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、式VIIによって表される式Iの化合物のサブクラス：

【化7】



10

VII

【0409】

[式中、

【0410】

R¹は、シクロアルキルおよびアリールからなる群より選択され、R¹は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0411】

R²は、アルキル、アリール、アラルキル、シクロアルキルアルキル、アラルケニル、およびアリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、R²は、R⁸およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、R²、またはR⁸と共に形成される不飽和縮合複素環は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールオキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0412】

R⁵は、水素およびアルキルからなる群より選択されるか、R⁵は、R⁶およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0413】

R⁶は、水素およびアルキルからなる群より選択されるか、R⁶は、R⁵およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；そして

【0414】

R⁸は、水素、アルキル、シクロアルキル、およびアリールからなる群より選択されるか、R⁸は、R²およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができる]

【0415】

またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグから選択される。

【0416】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式VIIの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

【0417】

R¹は、低級シクロアルキルおよびアリールからなる群より選択され、R¹は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0418】

20

30

40

50

R^2 は、低級アルキル、アリール、低級アラルキル、低級シクロアルキルアルキル、低級アラルケニル、および低級アリールシクロアルキルからなる群より選択されるか、 R^2 は、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される不飽和縮合複素環は、低級アルキル、ヒドロキシ、低級アルコキシ、アリールオキシ、およびハロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0419】

R^5 は、水素および低級アルキルからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができる；

【0420】

R^6 は、水素および低級アルキルからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、飽和5員または6員複素環を形成することができ、そして

【0421】

R^8 は、水素、低級アルキル、低級シクロアルキル、およびアリールからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、不飽和縮合複素環系を形成することができ。

【0422】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式VIIの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

【0423】

R^1 は、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、およびビフェニルからなる群より選択され、 R^1 は、メチル、エチル、プロピル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0424】

R^2 は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、フェニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ビフェニル、ベンジル、フェニルエチル、シクロペンチルメチル、シクロペンチルエチル、シクロペンチルプロピル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル、シクロヘキシルプロピル、フェニルエテニル、フェニルプロペニル、フェニルシクロプロピル、ビフェニルシクロプロピル、およびナフチルシクロプロピルからなる群より選択されるか、 R^2 は、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ジヒドロイソインドリル、ジヒドロインドリル、テトラヒドロイソキノリニル、およびテトラヒドロキノリニルからなる群より選択される環を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される環は、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、フェノキシ、ナフチルオキシ、ビフェニリルオキシ、クロロ、ブロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0425】

R^5 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、およびヘキシルからなる群より選択されるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ；

【0426】

R^6 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、およびヘキシルからなる群より選択されるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環またはピペリジニル環を形成することができ、そして

【0427】

R^8 は、水素、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ナフチル、およびビフェニルからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ジヒドロイソインドリ

10

20

30

40

50

ル、ジヒドロイソキノリニル、テトラヒドロイソキノリニル、およびテトラヒドロキノリニルからなる群より選択される環を形成することができる。

【0428】

もう一つの実施形態では、MCH受容体アンタゴニストが、以下の条件を満たす式VIIの化合物、またはその薬学的に許容できる塩、互変異性体もしくはプロドラッグからなる：式中、

【0429】

R^1 は、フェニル、およびナフチルからなる群より選択され、 R^1 は、メチル、クロロ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0430】

R^2 は、メチル、エチル、フェニル、ナフチル、ビフェニル、ベンジル、フェニルエチル、シクロペンチルエチル、フェニルエテニル、フェニルシクロプロピルからなる群より選択されるか、 R^2 は、 R^8 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ジヒドロイソイソキノリニル環を形成することができ、 R^2 、または R^8 と共に形成される環は、メチル、プロピル、メトキシ、フェノキシ、クロロ、プロモ、およびフルオロからなる群より選択される1以上の置換基で置換されていてもよい；

【0431】

R^5 は水素であるか、 R^5 は、 R^6 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環を形成する；

【0432】

R^6 は水素であるか、 R^6 は、 R^5 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ピロリジニル環を形成する；そして

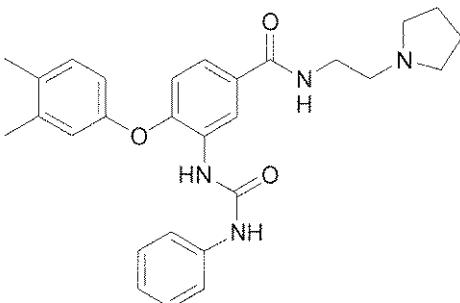
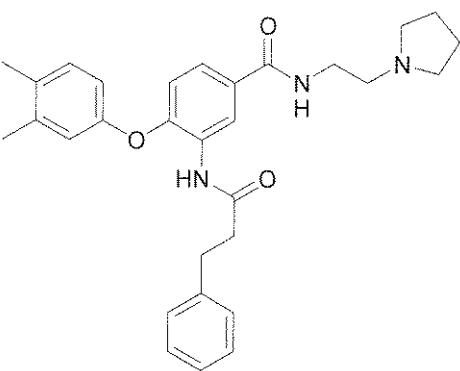
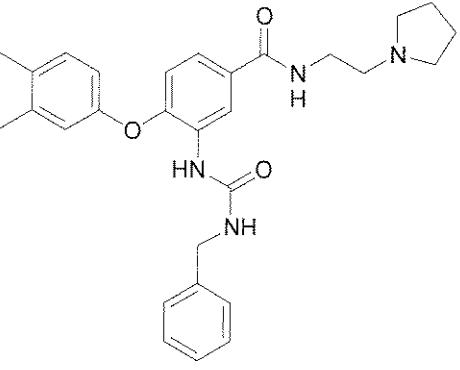
【0433】

R^8 は、水素、メチル、およびフェニルからなる群より選択されるか、 R^8 は、 R^2 およびそれらが結合している窒素と共に全体として、ジヒドロイソイソキノリニル環を形成することができる。

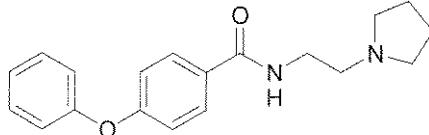
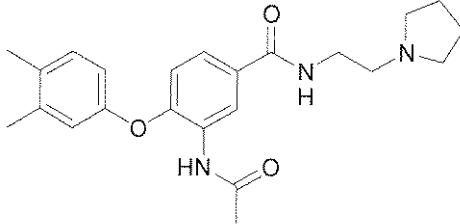
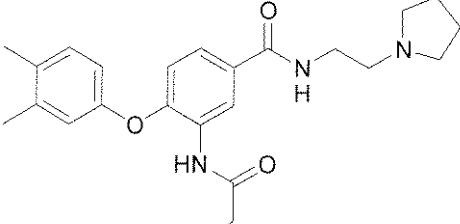
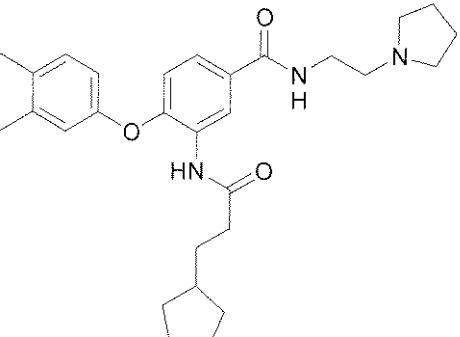
【0434】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、表1に列挙する化合物群から選択される。

【表1-1】

化合物番号	構造	
1	 <p>4-[3,4-ジメチルフェニル]オキシ]-3-{[(フェニルアミノ)カルボニル]アミノ}-N-(2-(1-ピロリジニル)エチル)ベンズアミド MS m/z 473 ($M+H$) ; MW 472</p>	10
5	 <p>4-[3,4-ジメチルフェニル]オキシ]-3-{[(3-フェニルプロパノイル)アミノ]-[2-(1-ピロリジニル)エチル]ベンズアミド MS m/z 486 ($M+H$) ; MW 485</p>	20
6	 <p>4-[3,4-ジメチルフェニル]オキシ]-3-{[(フェニルメチル)アミノ]カルボニル}アミノ)-N-(2-(1-ピロリジニル)エチル)ベンズアミド MS m/z 487 ($M+H$) ; MW 486</p>	30 40

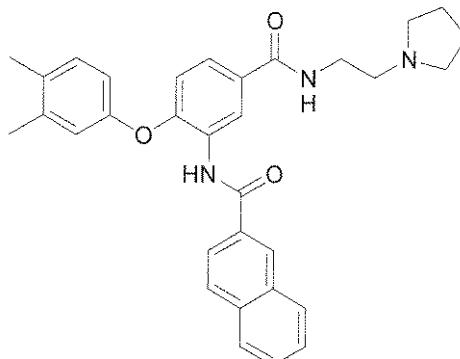
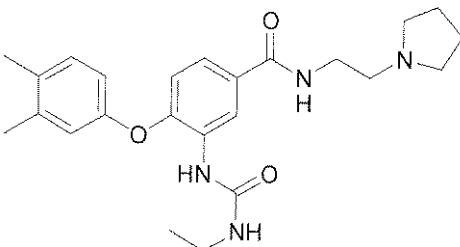
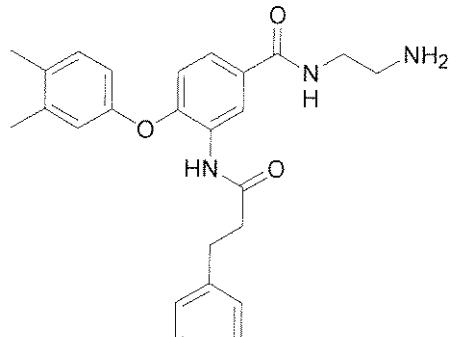
【表1-2】

化合物番号	構造	
8		
	4-(フェニルオキシ)-N-(2-(1-ピロリジニル)エチル)ベンズアミド MS m/z 311.4 ($M+H$) ; MW 310.4	10
10		
	3-アセチルアミノ-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 396 ($M+H$) ; MW 395	20
11		
	4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-プロピオニルアミノ-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 400 ($M+H$) ; MW 409	30
12		
	3-(3-シクロペンチルプロピオニルアミノ)-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 478 ($M+H$) ; MW 477	40

【表1-3】

化合物番号	構造	
13	<p>4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-(2-フェニルアセチル)ベンズアミド MS m/z 472 ($M+H$) ; MW 471</p>	10
15	<p>4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-(3-フェニルアクリロイル)ベンズアミド MS m/z 484 ($M+H$) ; MW 483</p>	20
16	<p>4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-[2-(2-フェニルシクロプロパンカルボニル)アミノ]-N-(2-ピロリジン-1-イルエチル)ベンズアミド MS m/z 498 ($M+H$) ; MW 497</p>	30 40

【表1-4】

化合物番号	構造	
17	 <p>ナフタレン-2-カルボン酸 [2-(3,4-ジメチルフェノキシ)-5-(2-ピロリジン-1-イル-エチルカルバモイル)フェニル]アミド MS m/z 508 ($M+H$) ; MW 507</p>	10
18	 <p>4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-(3-エチルウレイド)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 425 ($M+H$) ; MW 424</p>	20
20	 <p>N-(2-アミノエチル)-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-(3-フェニルプロピオニルアミノ)ベンズアミド MS m/z 432 ($M+H$) ; MW 431</p>	30 40

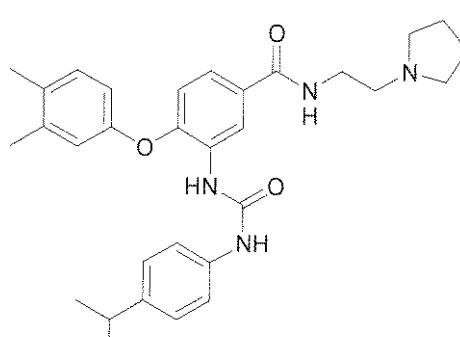
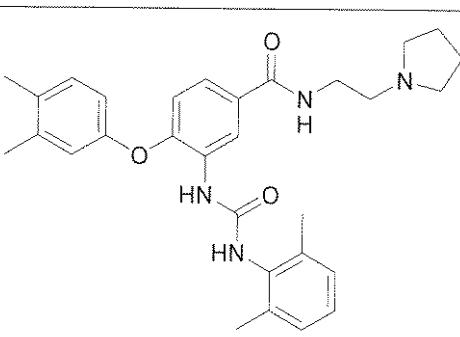
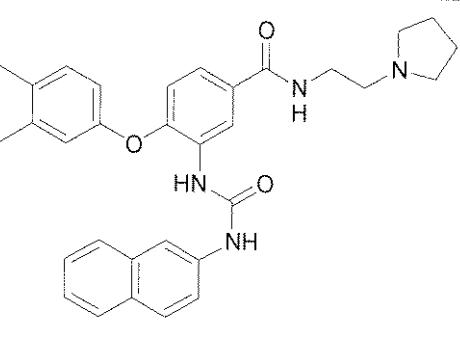
【表1-5】

化合物番号	構造	
22	<p>4-メトキシ-3-(3-フェニルプロピオニルアミノ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 508 ($M+H$) ; MW 507</p>	10
27	<p>4-(ナフタレン-2-イル-オキシ)-3-(3-フェニルプロピオニルアミノ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 502 ($M+H$) ; MW 501</p>	20
30	<p>4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-[3-(2-メトキシフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 503 ($M+H$) ; MW 502</p>	30 40

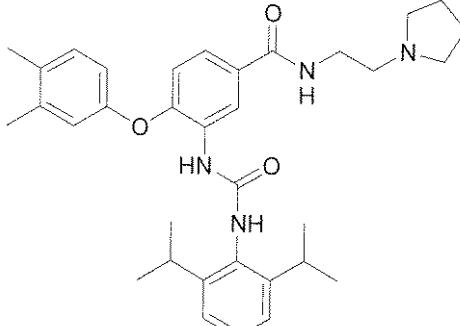
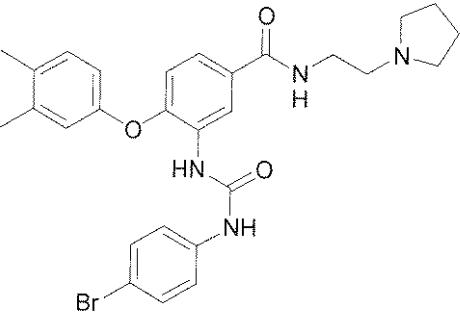
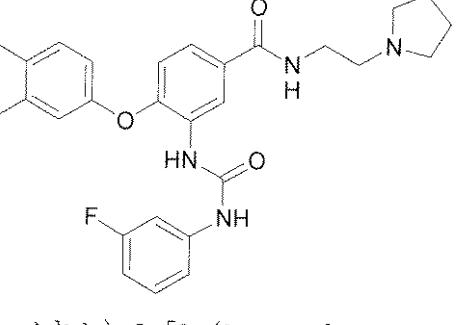
【表1-6】

化合物番号	構造	
31	<p>3-[3-(2,4-ジクロロフェニル)ウレイド]-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 542 ($M+H$) ; MW 541</p>	10
32	<p>4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-[3-(4-フェノキシフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 565 ($M+H$) ; MW 564</p>	20
33	<p>3-(3-ビフェニル-4-イル-ウレイド)-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 549 ($M+H$) ; MW 548</p>	30 40

【表1-7】

化合物番号	構造	
34	 <p>4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-[3-(4-イソプロピルフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 515 ($M+H$) ; MW 514</p>	10
35	 <p>4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-[3-(2,6-ジメチルフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 501 ($M+H$) ; MW 500</p>	20
36	 <p>4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-(3-ナフタレン-1-イル-ウレイド)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 523 ($M+H$) ; MW 522</p>	30 40

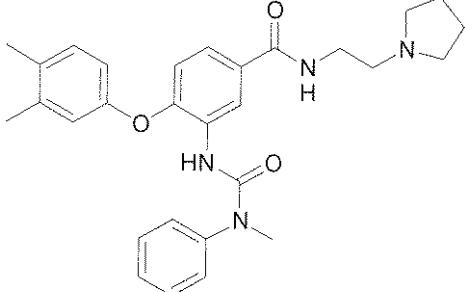
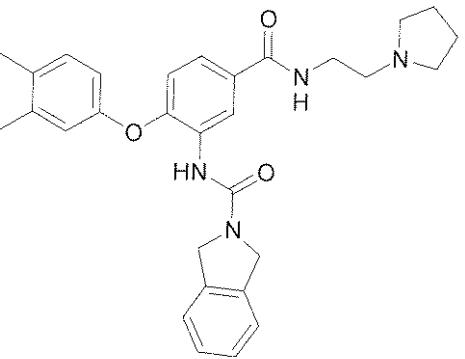
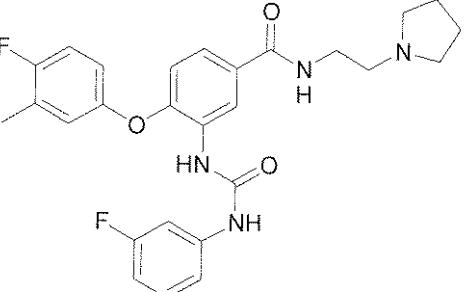
【表1-8】

化合物番号	構造	
37	 <p>3-[3-(2,6-ジイソプロピルフェニル)ウレイド]-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イルエチル)ベンズアミド MS m/z 557 ($M+H$) ; MW 556</p>	10
38	 <p>3-[3-(4-ブロモフェニル)ウレイド]-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イルエチル)ベンズアミド MS m/z 553 ($M+H$) ; MW 552</p>	20
39	 <p>4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-[3-(3-フルオロフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イルエチル)ベンズアミド MS m/z 491 ($M+H$) ; MW 490</p>	30 40

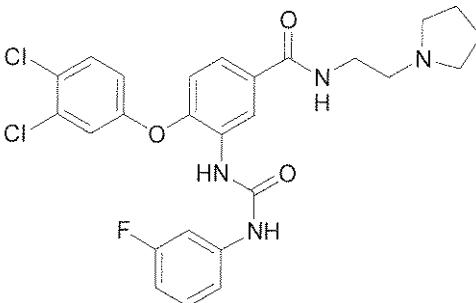
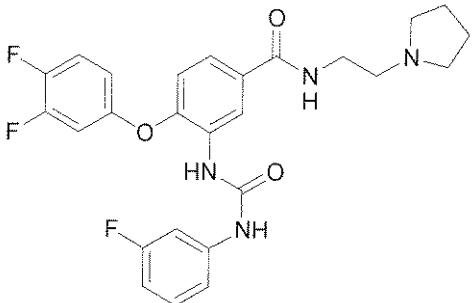
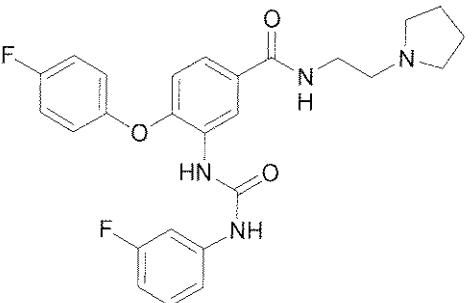
【表1-9】

化合物番号	構造	
40	<p>4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-[3-(3-メトキシフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 503 (M+H) ; MW 502</p>	10
41	<p>3-[3-(2-クロロフェニル)ウレイド]-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 507 (M+H) ; MW 506</p>	20
42	<p>4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-(3,3'-ジフェニルウレイド)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 549 (M+H) ; MW 548</p>	30 40

【表1-10】

化合物番号	構造	
43	 <p>4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-3-(3-メチル-3-フェニルウレイド)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 487 ($M+H$) ; MW 486</p>	10
50	 <p>1,3-ジヒドロイソインドール-2-カルボン酸 [2-(3,4-ジメチルフェノキシ)-5-(2-ピロリジン-1-イル-エチルカルバモイル)フェニル]アミド MS m/z 499 ($M+H$) ; MW 498</p>	20
51	 <p>4-(4-フルオロ-3-メチルフェノキシ)-3-[3-(3-フルオロフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS m/z 495 ($M+H$) ; MW 494</p>	30 40

【表1-11】

化合物番号	構造	
52	 <p>4-(3,4-ジクロロフェノキシ)-3-[3-(3-フルオロフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イルエチル)ベンズアミド MS m/z 531 ($M+H$) ; MW 530</p>	10
53	 <p>4-(3,4-ジフルオロフェノキシ)-3-[3-(3-フルオロフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イルエチル)ベンズアミド MS m/z 499 ($M+H$) ; MW 498</p>	20
54	 <p>4-(4-フルオロフェノキシ)-3-[3-(3-フルオロフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イルエチル)ベンズアミド MS m/z 481 ($M+H$) ; MW 480</p>	30 40

【表 1 - 1 2】

【表1-13】

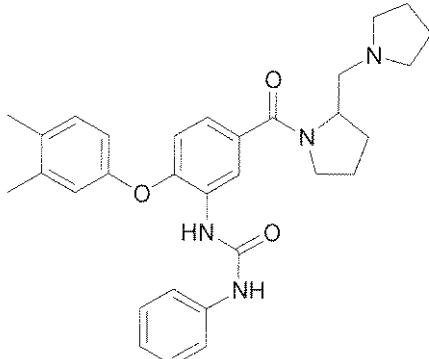
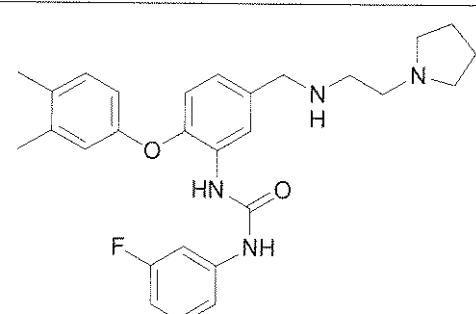
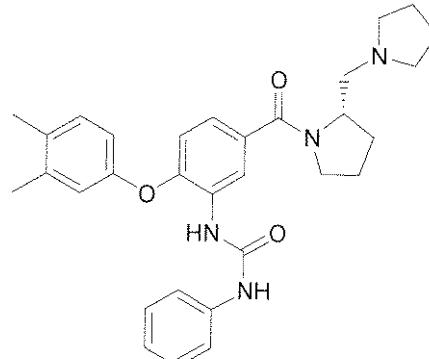
化合物番号	構造	
58		10
59		20
61		30 40

3-[3-(3,5-ジフルオロフェニル)ウレイド]-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド
MS m/z 509 ($M+H$) ; MW 508

3-[3-(3,5-ジクロロフェニル)ウレイド]-4-(3,4-ジメチルフェノキシ)-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド
MS m/z 541 ($M+H$) ; MW 540

3-[3-(3-フルオロフェニル)ウレイド]-4-フェノキシ-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド
MS m/z 463 ($M+H$) ; MW 462

【表1-14】

化合物番号	構造	
63	 <p>1-[2-(3,4-ジメチルフェノキシ)-5-(2-ピロリジン-1-イル-メチルピロリジン-1-カルボニル)フェニル]-3-フェニル尿素 MS m/z 513 (M+H) ; MW 512</p>	10
64	 <p>1-{2-(3,4-ジメチルフェノキシ)-5-[2-(2-エチルアミノエチルアミノ)-1-メチル]フェニル}-3-(3-フルオロフェニル)尿素 MS m/z 477 (M+H) ; MW 476</p>	20
65	 <p>1-[2-(3,4-ジメチルフェノキシ)-5-(2-ピロリジン-1-イル-メチルピロリジン-1-カルボニル)フェニル]-3-フェニル尿素 MS m/z 513 (M+H) ; MW 512</p>	30 40

【表1-15】

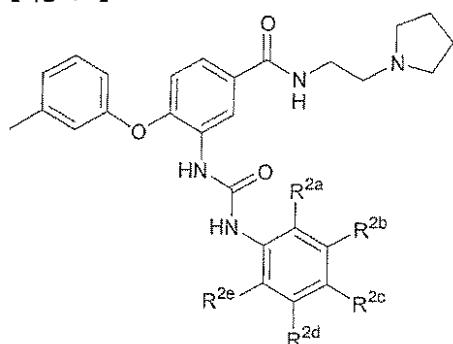
化合物番号	構造
66	<p>4-(3,4-ジクロロフェノキシ)-3-[3-(3,5-ジフルオロフェニル)ウレイド]-N-(2-ピロリジン-1-イル-エチル)ベンズアミド MS <i>m/z</i> 549 (M+H) ; MW 548</p>

10

【0435】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式Vの化合物群から選択される：

【化8】



20

30

【0436】

式中、R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R^{2d}、およびR^{2e}は、表2に定義するとおりである。

【表2-1】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
200	H	CH ₃	CH ₃	H	H
201	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
202	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
203	H	CH ₃	CH ₃	Cl	H
204	H	CH ₃	CH ₃	Br	H
205	H	CH ₃	CH ₃	F	H
206	H	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
207	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃

40

【表2-2】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
208	H	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃
209	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
210	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
211	H	CH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃
212	H	CH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃
213	H	CH ₃	CH ₃	F	OCH ₃
214	H	CH ₃	CH ₃	H	Cl
215	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
216	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl
217	H	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl
218	H	CH ₃	CH ₃	Br	Cl
219	H	CH ₃	CH ₃	F	Cl
220	H	CH ₃	CH ₃	H	Br
221	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
222	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br
223	H	CH ₃	CH ₃	Cl	Br
224	H	CH ₃	CH ₃	Br	Br
225	H	CH ₃	CH ₃	F	Br
226	H	CH ₃	CH ₃	H	F
227	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F
228	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	F
229	H	CH ₃	CH ₃	Cl	F
230	H	CH ₃	CH ₃	Br	F
231	H	CH ₃	CH ₃	F	F
232	H	CH ₃	OCH ₃	H	H
233	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
234	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H
235	H	CH ₃	OCH ₃	Cl	H
236	H	CH ₃	OCH ₃	Br	H
237	H	CH ₃	OCH ₃	F	H
238	H	CH ₃	OCH ₃	H	CH ₃
239	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
240	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
241	H	CH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃
242	H	CH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃
243	H	CH ₃	OCH ₃	F	CH ₃
244	H	CH ₃	OCH ₃	H	OCH ₃
245	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
246	H	CH ₃	OCH ₃	H	Cl
247	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl

10

20

30

40

【表2-3】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
248	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl
249	H	CH ₃	OCH ₃	Cl	Cl
250	H	CH ₃	OCH ₃	Br	Cl
251	H	CH ₃	OCH ₃	F	Cl
252	H	CH ₃	OCH ₃	H	Br
253	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br
254	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br
255	H	CH ₃	OCH ₃	Cl	Br
256	H	CH ₃	OCH ₃	Br	Br
257	H	CH ₃	OCH ₃	F	Br
258	H	CH ₃	OCH ₃	H	F
259	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	F
260	H	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F
261	H	CH ₃	OCH ₃	Cl	F
262	H	CH ₃	OCH ₃	Br	F
263	H	CH ₃	OCH ₃	F	F
264	H	CH ₃	Cl	H	H
265	H	CH ₃	Cl	CH ₃	H
266	H	CH ₃	Cl	OCH ₃	H
267	H	CH ₃	Cl	Cl	H
268	H	CH ₃	Cl	Br	H
269	H	CH ₃	Cl	F	H
270	H	CH ₃	Cl	H	CH ₃
271	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
272	H	CH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃
273	H	CH ₃	Cl	Cl	CH ₃
274	H	CH ₃	Cl	Br	CH ₃
275	H	CH ₃	Cl	F	CH ₃
276	H	CH ₃	Cl	H	OCH ₃
277	H	CH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃
278	H	CH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃
279	H	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃
280	H	CH ₃	Cl	Br	OCH ₃
281	H	CH ₃	Cl	F	OCH ₃
282	H	CH ₃	Cl	H	Cl
283	H	CH ₃	Cl	Cl	Cl
284	H	CH ₃	Cl	H	Br
285	H	CH ₃	Cl	CH ₃	Br
286	H	CH ₃	Cl	OCH ₃	Br
287	H	CH ₃	Cl	Cl	Br

10

20

30

40

【表2-4】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
288	H	CH ₃	Cl	Br	Br
289	H	CH ₃	Cl	F	Br
290	H	CH ₃	Cl	H	F
291	H	CH ₃	Cl	CH ₃	F
292	H	CH ₃	Cl	OCH ₃	F
293	H	CH ₃	Cl	Cl	F
294	H	CH ₃	Cl	F	F
295	H	CH ₃	Br	H	H
296	H	CH ₃	Br	CH ₃	H
297	H	CH ₃	Br	OCH ₃	H
298	H	CH ₃	Br	Cl	H
299	H	CH ₃	Br	Br	H
300	H	CH ₃	Br	F	H
301	H	CH ₃	Br	H	CH ₃
302	H	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃
303	H	CH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃
304	H	CH ₃	Br	Cl	CH ₃
305	H	CH ₃	Br	Br	CH ₃
306	H	CH ₃	Br	F	CH ₃
307	H	CH ₃	Br	H	OCH ₃
308	H	CH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃
309	H	CH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃
310	H	CH ₃	Br	Cl	OCH ₃
311	H	CH ₃	Br	Br	OCH ₃
312	H	CH ₃	Br	F	OCH ₃
313	H	CH ₃	Br	H	Cl
314	H	CH ₃	Br	CH ₃	Cl
315	H	CH ₃	Br	OCH ₃	Cl
316	H	CH ₃	Br	Cl	Cl
317	H	CH ₃	Br	Br	Cl
318	H	CH ₃	Br	F	Cl
319	H	CH ₃	Br	H	Br
320	H	CH ₃	Br	Br	Br
321	H	CH ₃	Br	H	F
322	H	CH ₃	Br	CH ₃	F
323	H	CH ₃	Br	OCH ₃	F
324	H	CH ₃	Br	Cl	F
325	H	CH ₃	Br	Br	F
326	H	CH ₃	Br	F	F
327	H	CH ₃	F	H	H

10

20

30

40

【表2-5】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
328	H	CH ₃	F	CH ₃	H
329	H	CH ₃	F	OCH ₃	H
330	H	CH ₃	F	Cl	H
331	H	CH ₃	F	Br	H
332	H	CH ₃	F	F	H
333	H	CH ₃	F	H	CH ₃
334	H	CH ₃	F	CH ₃	CH ₃
335	H	CH ₃	F	OCH ₃	CH ₃
336	H	CH ₃	F	Cl	CH ₃
337	H	CH ₃	F	Br	CH ₃
338	H	CH ₃	F	F	CH ₃
339	H	CH ₃	F	H	OCH ₃
340	H	CH ₃	F	CH ₃	OCH ₃
341	H	CH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃
342	H	CH ₃	F	Cl	OCH ₃
343	H	CH ₃	F	Br	OCH ₃
344	H	CH ₃	F	F	OCH ₃
345	H	CH ₃	F	H	Cl
346	H	CH ₃	F	CH ₃	Cl
347	H	CH ₃	F	OCH ₃	Cl
348	H	CH ₃	F	Cl	Cl
349	H	CH ₃	F	Br	Cl
350	H	CH ₃	F	F	Cl
351	H	CH ₃	F	H	Br
352	H	CH ₃	F	CH ₃	Br
353	H	CH ₃	F	OCH ₃	Br
354	H	CH ₃	F	Cl	Br
355	H	CH ₃	F	Br	Br
356	H	CH ₃	F	F	Br
357	H	CH ₃	F	H	F
358	H	CH ₃	F	F	F
359	H	OCH ₃	CH ₃	H	H
360	H	OCH ₃	CH ₃	H	CH ₃
361	H	OCH ₃	CH ₃	H	OCH ₃
362	H	OCH ₃	CH ₃	H	Cl
363	H	OCH ₃	CH ₃	H	Br
364	H	OCH ₃	CH ₃	H	F
365	H	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H
366	H	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
367	H	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-6】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
368	H	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
369	H	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
370	H	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	F
371	H	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
372	H	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
373	H	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl
374	H	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br
375	H	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	F
376	H	OCH ₃	CH ₃	Cl	H
377	H	OCH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃
378	H	OCH ₃	CH ₃	Cl	Cl
379	H	OCH ₃	CH ₃	Cl	Br
380	H	OCH ₃	CH ₃	Cl	F
381	H	OCH ₃	CH ₃	Br	H
382	H	OCH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃
383	H	OCH ₃	CH ₃	Br	Cl
384	H	OCH ₃	CH ₃	Br	Br
385	H	OCH ₃	CH ₃	Br	F
386	H	OCH ₃	CH ₃	F	H
387	H	OCH ₃	CH ₃	F	OCH ₃
388	H	OCH ₃	CH ₃	F	Cl
389	H	OCH ₃	CH ₃	F	Br
390	H	OCH ₃	CH ₃	F	F
391	H	OCH ₃	OCH ₃	H	H
392	H	OCH ₃	OCH ₃	H	CH ₃
393	H	OCH ₃	OCH ₃	H	OCH ₃
394	H	OCH ₃	OCH ₃	H	Cl
395	H	OCH ₃	OCH ₃	H	Br
396	H	OCH ₃	OCH ₃	H	F
397	H	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
398	H	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
399	H	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl
400	H	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br
401	H	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	F
402	H	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H
403	H	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
404	H	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
405	H	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl
406	H	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br
407	H	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F

10

20

30

40

【表2-7】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
408	H	OCH ₃	OCH ₃	Cl	H
409	H	OCH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃
410	H	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Cl
411	H	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Br
412	H	OCH ₃	OCH ₃	Cl	F
413	H	OCH ₃	OCH ₃	Br	H
414	H	OCH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃
415	H	OCH ₃	OCH ₃	Br	Cl
416	H	OCH ₃	OCH ₃	Br	Br
417	H	OCH ₃	OCH ₃	Br	F
418	H	OCH ₃	OCH ₃	F	H
419	H	OCH ₃	OCH ₃	F	CH ₃
420	H	OCH ₃	OCH ₃	F	Cl
421	H	OCH ₃	OCH ₃	F	Br
422	H	OCH ₃	OCH ₃	F	F
423	H	OCH ₃	Cl	H	H
424	H	OCH ₃	Cl	H	CH ₃
425	H	OCH ₃	Cl	H	OCH ₃
426	H	OCH ₃	Cl	H	Cl
427	H	OCH ₃	Cl	H	Br
428	H	OCH ₃	Cl	H	F
429	H	OCH ₃	Cl	CH ₃	H
430	H	OCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
431	H	OCH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃
432	H	OCH ₃	Cl	CH ₃	Br
433	H	OCH ₃	Cl	CH ₃	F
434	H	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H
435	H	OCH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃
436	H	OCH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃
437	H	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Br
438	H	OCH ₃	Cl	OCH ₃	F
439	H	OCH ₃	Cl	Cl	H
440	H	OCH ₃	Cl	Cl	CH ₃
441	H	OCH ₃	Cl	Cl	OCH ₃
442	H	OCH ₃	Cl	Cl	Cl
443	H	OCH ₃	Cl	Cl	Br
444	H	OCH ₃	Cl	Cl	F
445	H	OCH ₃	Cl	Br	H
446	H	OCH ₃	Cl	Br	CH ₃
447	H	OCH ₃	Cl	Br	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-8】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
448	H	OCH ₃	Cl	Br	Br
449	H	OCH ₃	Cl	F	H
450	H	OCH ₃	Cl	F	CH ₃
451	H	OCH ₃	Cl	F	OCH ₃
452	H	OCH ₃	Cl	F	Br
453	H	OCH ₃	Cl	F	F
454	H	OCH ₃	Br	H	H
455	H	OCH ₃	Br	H	CH ₃
456	H	OCH ₃	Br	H	OCH ₃
457	H	OCH ₃	Br	H	Cl
458	H	OCH ₃	Br	H	Br
459	H	OCH ₃	Br	H	F
460	H	OCH ₃	Br	CH ₃	H
461	H	OCH ₃	Br	CH ₃	CH ₃
462	H	OCH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃
463	H	OCH ₃	Br	CH ₃	Cl
464	H	OCH ₃	Br	CH ₃	F
465	H	OCH ₃	Br	OCH ₃	H
466	H	OCH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃
467	H	OCH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃
468	H	OCH ₃	Br	OCH ₃	Cl
469	H	OCH ₃	Br	OCH ₃	F
470	H	OCH ₃	Br	Cl	H
471	H	OCH ₃	Br	Cl	CH ₃
472	H	OCH ₃	Br	Cl	OCH ₃
473	H	OCH ₃	Br	Cl	Cl
474	H	OCH ₃	Br	Cl	F
475	H	OCH ₃	Br	Br	H
476	H	OCH ₃	Br	Br	CH ₃
477	H	OCH ₃	Br	Br	OCH ₃
478	H	OCH ₃	Br	Br	Cl
479	H	OCH ₃	Br	Br	Br
480	H	OCH ₃	Br	Br	F
481	H	OCH ₃	Br	F	H
482	H	OCH ₃	Br	F	CH ₃
483	H	OCH ₃	Br	F	OCH ₃
484	H	OCH ₃	Br	F	Cl
485	H	OCH ₃	Br	F	F
486	H	OCH ₃	F	H	H
487	H	OCH ₃	F	H	CH ₃

10

20

30

40

【表2-9】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
488	H	OCH ₃	F	H	OCH ₃
489	H	OCH ₃	F	H	Cl
490	H	OCH ₃	F	H	Br
491	H	OCH ₃	F	H	F
492	H	OCH ₃	F	CH ₃	H
493	H	OCH ₃	F	CH ₃	CH ₃
494	H	OCH ₃	F	CH ₃	OCH ₃
495	H	OCH ₃	F	CH ₃	Cl
496	H	OCH ₃	F	CH ₃	Br
497	H	OCH ₃	F	OCH ₃	H
498	H	OCH ₃	F	OCH ₃	CH ₃
499	H	OCH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃
500	H	OCH ₃	F	OCH ₃	Cl
501	H	OCH ₃	F	OCH ₃	Br
502	H	OCH ₃	F	Cl	H
503	H	OCH ₃	F	Cl	CH ₃
504	H	OCH ₃	F	Cl	OCH ₃
505	H	OCH ₃	F	Cl	Cl
506	H	OCH ₃	F	Cl	Br
507	H	OCH ₃	F	Br	H
508	H	OCH ₃	F	Br	CH ₃
509	H	OCH ₃	F	Br	OCH ₃
510	H	OCH ₃	F	Br	Cl
511	H	OCH ₃	F	Br	Br
512	H	OCH ₃	F	F	H
513	H	OCH ₃	F	F	CH ₃
514	H	OCH ₃	F	F	OCH ₃
515	H	OCH ₃	F	F	Cl
516	H	OCH ₃	F	F	Br
517	H	OCH ₃	F	F	F
518	H	Cl	CH ₃	H	H
519	H	Cl	CH ₃	H	CH ₃
520	H	Cl	CH ₃	H	OCH ₃
521	H	Cl	CH ₃	H	Cl
522	H	Cl	CH ₃	H	Br
523	H	Cl	CH ₃	H	F
524	H	Cl	CH ₃	CH ₃	H
525	H	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
526	H	Cl	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
527	H	Cl	CH ₃	CH ₃	Cl

10

20

30

40

【表2-10】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
528	H	Cl	CH ₃	CH ₃	Br
529	H	Cl	CH ₃	CH ₃	F
530	H	Cl	CH ₃	OCH ₃	H
531	H	Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
532	H	Cl	CH ₃	OCH ₃	Cl
533	H	Cl	CH ₃	OCH ₃	Br
534	H	Cl	CH ₃	OCH ₃	F
535	H	Cl	CH ₃	Cl	H
536	H	Cl	CH ₃	Cl	OCH ₃
537	H	Cl	CH ₃	Cl	Cl
538	H	Cl	CH ₃	Cl	Br
539	H	Cl	CH ₃	Cl	F
540	H	Cl	CH ₃	Br	H
541	H	Cl	CH ₃	Br	OCH ₃
542	H	Cl	CH ₃	Br	Cl
543	H	Cl	CH ₃	Br	Br
544	H	Cl	CH ₃	Br	F
545	H	Cl	CH ₃	F	H
546	H	Cl	CH ₃	F	OCH ₃
547	H	Cl	CH ₃	F	Cl
548	H	Cl	CH ₃	F	Br
549	H	Cl	CH ₃	F	F
550	H	Cl	OCH ₃	H	H
551	H	Cl	OCH ₃	H	CH ₃
552	H	Cl	OCH ₃	H	OCH ₃
553	H	Cl	OCH ₃	H	Cl
554	H	Cl	OCH ₃	H	Br
555	H	Cl	OCH ₃	H	F
556	H	Cl	OCH ₃	CH ₃	H
557	H	Cl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
558	H	Cl	OCH ₃	CH ₃	Cl
559	H	Cl	OCH ₃	CH ₃	Br
560	H	Cl	OCH ₃	CH ₃	F
561	H	Cl	OCH ₃	OCH ₃	H
562	H	Cl	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
563	H	Cl	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
564	H	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Cl
565	H	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Br
566	H	Cl	OCH ₃	OCH ₃	F
567	H	Cl	OCH ₃	Cl	H

10

20

30

40

【表2-11】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
568	H	Cl	OCH ₃	Cl	CH ₃
569	H	Cl	OCH ₃	Cl	Cl
570	H	Cl	OCH ₃	Cl	Br
571	H	Cl	OCH ₃	Cl	F
572	H	Cl	OCH ₃	Br	H
573	H	Cl	OCH ₃	Br	CH ₃
574	H	Cl	OCH ₃	Br	Cl
575	H	Cl	OCH ₃	Br	Br
576	H	Cl	OCH ₃	Br	F
577	H	Cl	OCH ₃	F	H
578	H	Cl	OCH ₃	F	CH ₃
579	H	Cl	OCH ₃	F	Cl
580	H	Cl	OCH ₃	F	Br
581	H	Cl	OCH ₃	F	F
582	H	Cl	Cl	H	H
583	H	Cl	Cl	H	CH ₃
584	H	Cl	Cl	H	OCH ₃
585	H	Cl	Cl	H	Cl
586	H	Cl	Cl	H	Br
587	H	Cl	Cl	H	F
588	H	Cl	Cl	CH ₃	H
589	H	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃
590	H	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃
591	H	Cl	Cl	CH ₃	Br
592	H	Cl	Cl	CH ₃	F
593	H	Cl	Cl	OCH ₃	H
594	H	Cl	Cl	OCH ₃	CH ₃
595	H	Cl	Cl	OCH ₃	OCH ₃
596	H	Cl	Cl	OCH ₃	Br
597	H	Cl	Cl	OCH ₃	F
598	H	Cl	Cl	Cl	H
599	H	Cl	Cl	Cl	CH ₃
600	H	Cl	Cl	Cl	OCH ₃
601	H	Cl	Cl	Cl	Cl
602	H	Cl	Cl	Cl	Br
603	H	Cl	Cl	Cl	F
604	H	Cl	Cl	Br	H
605	H	Cl	Cl	Br	CH ₃
606	H	Cl	Cl	Br	OCH ₃
607	H	Cl	Cl	Br	Br

10

20

30

40

【表2-12】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
608	H	Cl	Cl	F	H
609	H	Cl	Cl	F	CH ₃
610	H	Cl	Cl	F	OCH ₃
611	H	Cl	Cl	F	Br
612	H	Cl	Cl	F	F
613	H	Cl	Br	H	H
614	H	Cl	Br	H	CH ₃
615	H	Cl	Br	H	OCH ₃
616	H	Cl	Br	H	Cl
617	H	Cl	Br	H	Br
618	H	Cl	Br	H	F
619	H	Cl	Br	CH ₃	H
620	H	Cl	Br	CH ₃	CH ₃
621	H	Cl	Br	CH ₃	OCH ₃
622	H	Cl	Br	CH ₃	Cl
623	H	Cl	Br	CH ₃	F
624	H	Cl	Br	OCH ₃	H
625	H	Cl	Br	OCH ₃	CH ₃
626	H	Cl	Br	OCH ₃	OCH ₃
627	H	Cl	Br	OCH ₃	Cl
628	H	Cl	Br	OCH ₃	F
629	H	Cl	Br	Cl	H
630	H	Cl	Br	Cl	CH ₃
631	H	Cl	Br	Cl	OCH ₃
632	H	Cl	Br	Cl	Cl
633	H	Cl	Br	Cl	F
634	H	Cl	Br	Br	H
635	H	Cl	Br	Br	CH ₃
636	H	Cl	Br	Br	OCH ₃
637	H	Cl	Br	Br	Cl
638	H	Cl	Br	Br	Br
639	H	Cl	Br	Br	F
640	H	Cl	Br	F	H
641	H	Cl	Br	F	CH ₃
642	H	Cl	Br	F	OCH ₃
643	H	Cl	Br	F	Cl
644	H	Cl	Br	F	F
645	H	Cl	F	H	H
646	H	Cl	F	H	CH ₃
647	H	Cl	F	H	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-13】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
648	H	Cl	F	H	Cl
649	H	Cl	F	H	Br
650	H	Cl	F	H	F
651	H	Cl	F	CH ₃	H
652	H	Cl	F	CH ₃	CH ₃
653	H	Cl	F	CH ₃	OCH ₃
654	H	Cl	F	CH ₃	Cl
655	H	Cl	F	CH ₃	Br
656	H	Cl	F	OCH ₃	H
657	H	Cl	F	OCH ₃	CH ₃
658	H	Cl	F	OCH ₃	OCH ₃
659	H	Cl	F	OCH ₃	Cl
660	H	Cl	F	OCH ₃	Br
661	H	Cl	F	Cl	H
662	H	Cl	F	Cl	CH ₃
663	H	Cl	F	Cl	OCH ₃
664	H	Cl	F	Cl	Cl
665	H	Cl	F	Cl	Br
666	H	Cl	F	Br	H
667	H	Cl	F	Br	CH ₃
668	H	Cl	F	Br	OCH ₃
669	H	Cl	F	Br	Cl
670	H	Cl	F	Br	Br
671	H	Cl	F	F	H
672	H	Cl	F	F	CH ₃
673	H	Cl	F	F	OCH ₃
674	H	Cl	F	F	Cl
675	H	Cl	F	F	Br
676	H	Cl	F	F	F
677	H	Br	CH ₃	H	H
678	H	Br	CH ₃	H	CH ₃
679	H	Br	CH ₃	H	OCH ₃
680	H	Br	CH ₃	H	Cl
681	H	Br	CH ₃	H	Br
682	H	Br	CH ₃	H	F
683	H	Br	CH ₃	CH ₃	H
684	H	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃
685	H	Br	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
686	H	Br	CH ₃	CH ₃	Cl
687	H	Br	CH ₃	CH ₃	Br

10

20

30

40

【表2-14】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
688	H	Br	CH ₃	CH ₃	F
689	H	Br	CH ₃	OCH ₃	H
690	H	Br	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
691	H	Br	CH ₃	OCH ₃	Cl
692	H	Br	CH ₃	OCH ₃	Br
693	H	Br	CH ₃	OCH ₃	F
694	H	Br	CH ₃	Cl	H
695	H	Br	CH ₃	Cl	OCH ₃
696	H	Br	CH ₃	Cl	Cl
697	H	Br	CH ₃	Cl	Br
698	H	Br	CH ₃	Cl	F
699	H	Br	CH ₃	Br	H
700	H	Br	CH ₃	Br	OCH ₃
701	H	Br	CH ₃	Br	Cl
702	H	Br	CH ₃	Br	Br
703	H	Br	CH ₃	Br	F
704	H	Br	CH ₃	F	H
705	H	Br	CH ₃	F	OCH ₃
706	H	Br	CH ₃	F	Cl
707	H	Br	CH ₃	F	Br
708	H	Br	CH ₃	F	F
709	H	Br	OCH ₃	H	H
710	H	Br	OCH ₃	H	CH ₃
711	H	Br	OCH ₃	H	OCH ₃
712	H	Br	OCH ₃	H	Cl
713	H	Br	OCH ₃	H	Br
714	H	Br	OCH ₃	H	F
715	H	Br	OCH ₃	CH ₃	H
716	H	Br	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
717	H	Br	OCH ₃	CH ₃	Cl
718	H	Br	OCH ₃	CH ₃	Br
719	H	Br	OCH ₃	CH ₃	F
720	H	Br	OCH ₃	OCH ₃	H
721	H	Br	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
722	H	Br	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
723	H	Br	OCH ₃	OCH ₃	Cl
724	H	Br	OCH ₃	OCH ₃	Br
725	H	Br	OCH ₃	OCH ₃	F
726	H	Br	OCH ₃	Cl	H
727	H	Br	OCH ₃	Cl	CH ₃

10

20

30

40

【表2-15】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
728	H	Br	OCH ₃	Cl	Cl
729	H	Br	OCH ₃	Cl	Br
730	H	Br	OCH ₃	Cl	F
731	H	Br	OCH ₃	Br	H
732	H	Br	OCH ₃	Br	CH ₃
733	H	Br	OCH ₃	Br	Cl
734	H	Br	OCH ₃	Br	Br
735	H	Br	OCH ₃	Br	F
736	H	Br	OCH ₃	F	H
737	H	Br	OCH ₃	F	CH ₃
738	H	Br	OCH ₃	F	Cl
739	H	Br	OCH ₃	F	Br
740	H	Br	OCH ₃	F	F
741	H	Br	Cl	H	H
742	H	Br	Cl	H	CH ₃
743	H	Br	Cl	H	OCH ₃
744	H	Br	Cl	H	Cl
745	H	Br	Cl	H	Br
746	H	Br	Cl	H	F
747	H	Br	Cl	CH ₃	H
748	H	Br	Cl	CH ₃	CH ₃
749	H	Br	Cl	CH ₃	OCH ₃
750	H	Br	Cl	CH ₃	Br
751	H	Br	Cl	CH ₃	F
752	H	Br	Cl	OCH ₃	H
753	H	Br	Cl	OCH ₃	CH ₃
754	H	Br	Cl	OCH ₃	OCH ₃
755	H	Br	Cl	OCH ₃	Br
756	H	Br	Cl	OCH ₃	F
757	H	Br	Cl	Cl	H
758	H	Br	Cl	Cl	CH ₃
759	H	Br	Cl	Cl	OCH ₃
760	H	Br	Cl	Cl	Cl
761	H	Br	Cl	Cl	Br
762	H	Br	Cl	Cl	F
763	H	Br	Cl	Br	H
764	H	Br	Cl	Br	CH ₃
765	H	Br	Cl	Br	OCH ₃
766	H	Br	Cl	Br	Br
767	H	Br	Cl	F	H

10

20

30

40

【表2-16】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
768	H	Br	Cl	F	CH ₃
769	H	Br	Cl	F	OCH ₃
770	H	Br	Cl	F	Br
771	H	Br	Cl	F	F
772	H	Br	Br	H	H
773	H	Br	Br	H	CH ₃
774	H	Br	Br	H	OCH ₃
775	H	Br	Br	H	Cl
776	H	Br	Br	H	Br
777	H	Br	Br	H	F
778	H	Br	Br	CH ₃	H
779	H	Br	Br	CH ₃	CH ₃
780	H	Br	Br	CH ₃	OCH ₃
781	H	Br	Br	CH ₃	Cl
782	H	Br	Br	CH ₃	F
783	H	Br	Br	OCH ₃	H
784	H	Br	Br	OCH ₃	CH ₃
785	H	Br	Br	OCH ₃	OCH ₃
786	H	Br	Br	OCH ₃	Cl
787	H	Br	Br	OCH ₃	F
788	H	Br	Br	Cl	H
789	H	Br	Br	Cl	CH ₃
790	H	Br	Br	Cl	OCH ₃
791	H	Br	Br	Cl	Cl
792	H	Br	Br	Cl	F
793	H	Br	Br	Br	H
794	H	Br	Br	Br	CH ₃
795	H	Br	Br	Br	OCH ₃
796	H	Br	Br	Br	Cl
797	H	Br	Br	Br	Br
798	H	Br	Br	Br	F
799	H	Br	Br	F	H
800	H	Br	Br	F	CH ₃
801	H	Br	Br	F	OCH ₃
802	H	Br	Br	F	Cl
803	H	Br	Br	F	F
804	H	Br	F	H	H
805	H	Br	F	H	CH ₃
806	H	Br	F	H	OCH ₃
807	H	Br	F	H	Cl

10

20

30

40

【表2-17】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
808	H	Br	F	H	Br
809	H	Br	F	H	F
810	H	Br	F	CH ₃	H
811	H	Br	F	CH ₃	CH ₃
812	H	Br	F	CH ₃	OCH ₃
813	H	Br	F	CH ₃	Cl
814	H	Br	F	CH ₃	Br
815	H	Br	F	OCH ₃	H
816	H	Br	F	OCH ₃	CH ₃
817	H	Br	F	OCH ₃	OCH ₃
818	H	Br	F	OCH ₃	Cl
819	H	Br	F	OCH ₃	Br
820	H	Br	F	Cl	H
821	H	Br	F	Cl	CH ₃
822	H	Br	F	Cl	OCH ₃
823	H	Br	F	Cl	Cl
824	H	Br	F	Cl	Br
825	H	Br	F	Br	H
826	H	Br	F	Br	CH ₃
827	H	Br	F	Br	OCH ₃
828	H	Br	F	Br	Cl
829	H	Br	F	Br	Br
830	H	Br	F	F	H
831	H	Br	F	F	CH ₃
832	H	Br	F	F	OCH ₃
833	H	Br	F	F	Cl
834	H	Br	F	F	Br
835	H	Br	F	F	F
836	H	F	CH ₃	H	H
837	H	F	CH ₃	H	CH ₃
838	H	F	CH ₃	H	OCH ₃
839	H	F	CH ₃	H	Cl
840	H	F	CH ₃	H	Br
841	H	F	CH ₃	H	F
842	H	F	CH ₃	CH ₃	H
843	H	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
844	H	F	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
845	H	F	CH ₃	CH ₃	Cl
846	H	F	CH ₃	CH ₃	Br
847	H	F	CH ₃	CH ₃	F

10

20

30

40

【表2-18】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
848	H	F	CH ₃	OCH ₃	H
849	H	F	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
850	H	F	CH ₃	OCH ₃	Cl
851	H	F	CH ₃	OCH ₃	Br
852	H	F	CH ₃	OCH ₃	F
853	H	F	CH ₃	Cl	H
854	H	F	CH ₃	Cl	OCH ₃
855	H	F	CH ₃	Cl	Cl
856	H	F	CH ₃	Cl	Br
857	H	F	CH ₃	Cl	F
858	H	F	CH ₃	Br	H
859	H	F	CH ₃	Br	OCH ₃
860	H	F	CH ₃	Br	Cl
861	H	F	CH ₃	Br	Br
862	H	F	CH ₃	Br	F
863	H	F	CH ₃	F	H
864	H	F	CH ₃	F	OCH ₃
865	H	F	CH ₃	F	Cl
866	H	F	CH ₃	F	Br
867	H	F	CH ₃	F	F
868	H	F	OCH ₃	H	H
869	H	F	OCH ₃	H	CH ₃
870	H	F	OCH ₃	H	OCH ₃
871	H	F	OCH ₃	H	Cl
872	H	F	OCH ₃	H	Br
873	H	F	OCH ₃	H	F
874	H	F	OCH ₃	CH ₃	H
875	H	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
876	H	F	OCH ₃	CH ₃	Cl
877	H	F	OCH ₃	CH ₃	Br
878	H	F	OCH ₃	CH ₃	F
879	H	F	OCH ₃	OCH ₃	H
880	H	F	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
881	H	F	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
882	H	F	OCH ₃	OCH ₃	Cl
883	H	F	OCH ₃	OCH ₃	Br
884	H	F	OCH ₃	OCH ₃	F
885	H	F	OCH ₃	Cl	H
886	H	F	OCH ₃	Cl	CH ₃
887	H	F	OCH ₃	Cl	Cl

10

20

30

40

【表2-19】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
888	H	F	OCH ₃	Cl	Br
889	H	F	OCH ₃	Cl	F
890	H	F	OCH ₃	Br	H
891	H	F	OCH ₃	Br	CH ₃
892	H	F	OCH ₃	Br	Cl
893	H	F	OCH ₃	Br	Br
894	H	F	OCH ₃	Br	F
895	H	F	OCH ₃	F	H
896	H	F	OCH ₃	F	CH ₃
897	H	F	OCH ₃	F	Cl
898	H	F	OCH ₃	F	Br
899	H	F	OCH ₃	F	F
900	H	F	Cl	H	H
901	H	F	Cl	H	CH ₃
902	H	F	Cl	H	OCH ₃
903	H	F	Cl	H	Cl
904	H	F	Cl	H	Br
905	H	F	Cl	H	F
906	H	F	Cl	CH ₃	H
907	H	F	Cl	CH ₃	CH ₃
908	H	F	Cl	CH ₃	OCH ₃
909	H	F	Cl	CH ₃	Br
910	H	F	Cl	CH ₃	F
911	H	F	Cl	OCH ₃	H
912	H	F	Cl	OCH ₃	CH ₃
913	H	F	Cl	OCH ₃	OCH ₃
914	H	F	Cl	OCH ₃	Br
915	H	F	Cl	OCH ₃	F
916	H	F	Cl	Cl	H
917	H	F	Cl	Cl	CH ₃
918	H	F	Cl	Cl	OCH ₃
919	H	F	Cl	Cl	Cl
920	H	F	Cl	Cl	Br
921	H	F	Cl	Cl	F
922	H	F	Cl	Br	H
923	H	F	Cl	Br	CH ₃
924	H	F	Cl	Br	OCH ₃
925	H	F	Cl	Br	Br
926	H	F	Cl	F	H
927	H	F	Cl	F	CH ₃

10

20

30

40

【表2-20】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
928	H	F	Cl	F	OCH ₃
929	H	F	Cl	F	Br
930	H	F	Cl	F	F
931	H	F	Br	H	H
932	H	F	Br	H	CH ₃
933	H	F	Br	H	OCH ₃
934	H	F	Br	H	Cl
935	H	F	Br	H	Br
936	H	F	Br	H	F
937	H	F	Br	CH ₃	H
938	H	F	Br	CH ₃	CH ₃
939	H	F	Br	CH ₃	OCH ₃
940	H	F	Br	CH ₃	Cl
941	H	F	Br	CH ₃	F
942	H	F	Br	OCH ₃	H
943	H	F	Br	OCH ₃	CH ₃
944	H	F	Br	OCH ₃	OCH ₃
945	H	F	Br	OCH ₃	Cl
946	H	F	Br	OCH ₃	F
947	H	F	Br	Cl	H
948	H	F	Br	Cl	CH ₃
949	H	F	Br	Cl	OCH ₃
950	H	F	Br	Cl	Cl
951	H	F	Br	Cl	F
952	H	F	Br	Br	H
953	H	F	Br	Br	CH ₃
954	H	F	Br	Br	OCH ₃
955	H	F	Br	Br	Cl
956	H	F	Br	Br	Br
957	H	F	Br	Br	F
958	H	F	Br	F	H
959	H	F	Br	F	CH ₃
960	H	F	Br	F	OCH ₃
961	H	F	Br	F	Cl
962	H	F	Br	F	F
963	H	F	F	H	H
964	H	F	F	H	CH ₃
965	H	F	F	H	OCH ₃
966	H	F	F	H	Cl
967	H	F	F	H	Br

10

20

30

40

【表2-21】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
968	H	F	F	H	F
969	H	F	F	CH ₃	H
970	H	F	F	CH ₃	CH ₃
971	H	F	F	CH ₃	OCH ₃
972	H	F	F	CH ₃	Cl
973	H	F	F	CH ₃	Br
974	H	F	F	OCH ₃	H
975	H	F	F	OCH ₃	CH ₃
976	H	F	F	OCH ₃	OCH ₃
977	H	F	F	OCH ₃	Cl
978	H	F	F	OCH ₃	Br
979	H	F	F	Cl	H
980	H	F	F	Cl	CH ₃
981	H	F	F	Cl	OCH ₃
982	H	F	F	Cl	Cl
983	H	F	F	Cl	Br
984	H	F	F	Br	H
985	H	F	F	Br	CH ₃
986	H	F	F	Br	OCH ₃
987	H	F	F	Br	Cl
988	H	F	F	Br	Br
989	H	F	F	F	H
990	H	F	F	F	CH ₃
991	H	F	F	F	OCH ₃
992	H	F	F	F	Cl
993	H	F	F	F	Br
994	H	F	F	F	F
995	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H
996	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
997	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
998	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	H
999	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	H
1000	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F	H
1001	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
1002	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
1003	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃
1004	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
1005	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
1006	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃
1007	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-22】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1008	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F	OCH ₃
1009	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Cl
1010	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
1011	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl
1012	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl
1013	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	Cl
1014	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F	Cl
1015	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Br
1016	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
1017	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br
1018	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	Br
1019	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	Br
1020	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F	Br
1021	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	F
1022	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F
1023	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	F
1024	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	F
1025	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	F
1026	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F	F
1027	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H	H
1028	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
1029	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H
1030	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl	H
1031	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br	H
1032	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	F	H
1033	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H	CH ₃
1034	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
1035	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
1036	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃
1037	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃
1038	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	F	CH ₃
1039	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H	OCH ₃
1040	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
1041	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H	Cl
1042	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl
1043	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl
1044	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl	Cl
1045	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br	Cl
1046	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	F	Cl
1047	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H	Br

10

20

30

40

【表2-23】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1048	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br
1049	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br
1050	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl	Br
1051	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br	Br
1052	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	F	Br
1053	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H	F
1054	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	F
1055	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F
1056	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl	F
1057	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br	F
1058	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	F	F
1059	CH ₃	CH ₃	Cl	H	H
1060	CH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃	H
1061	CH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃	H
1062	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl	H
1063	CH ₃	CH ₃	Cl	Br	H
1064	CH ₃	CH ₃	Cl	F	H
1065	CH ₃	CH ₃	Cl	H	CH ₃
1066	CH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
1067	CH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃
1068	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl	CH ₃
1069	CH ₃	CH ₃	Cl	Br	CH ₃
1070	CH ₃	CH ₃	Cl	F	CH ₃
1071	CH ₃	CH ₃	Cl	H	OCH ₃
1072	CH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃
1073	CH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃
1074	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃
1075	CH ₃	CH ₃	Cl	Br	OCH ₃
1076	CH ₃	CH ₃	Cl	F	OCH ₃
1077	CH ₃	CH ₃	Cl	H	Cl
1078	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl	Cl
1079	CH ₃	CH ₃	Cl	H	Br
1080	CH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃	Br
1081	CH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃	Br
1082	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl	Br
1083	CH ₃	CH ₃	Cl	Br	Br
1084	CH ₃	CH ₃	Cl	F	Br
1085	CH ₃	CH ₃	Cl	H	F
1086	CH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃	F
1087	CH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃	F

10

20

30

40

【表2-24】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1088	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl	F
1089	CH ₃	CH ₃	Cl	F	F
1090	CH ₃	CH ₃	Br	H	H
1091	CH ₃	CH ₃	Br	CH ₃	H
1092	CH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃	H
1093	CH ₃	CH ₃	Br	Cl	H
1094	CH ₃	CH ₃	Br	Br	H
1095	CH ₃	CH ₃	Br	F	H
1096	CH ₃	CH ₃	Br	H	CH ₃
1097	CH ₃	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃
1098	CH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃
1099	CH ₃	CH ₃	Br	Cl	CH ₃
1100	CH ₃	CH ₃	Br	Br	CH ₃
1101	CH ₃	CH ₃	Br	F	CH ₃
1102	CH ₃	CH ₃	Br	H	OCH ₃
1103	CH ₃	CH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃
1104	CH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃
1105	CH ₃	CH ₃	Br	Cl	OCH ₃
1106	CH ₃	CH ₃	Br	Br	OCH ₃
1107	CH ₃	CH ₃	Br	F	OCH ₃
1108	CH ₃	CH ₃	Br	H	Cl
1109	CH ₃	CH ₃	Br	CH ₃	Cl
1110	CH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃	Cl
1111	CH ₃	CH ₃	Br	Cl	Cl
1112	CH ₃	CH ₃	Br	Br	Cl
1113	CH ₃	CH ₃	Br	F	Cl
1114	CH ₃	CH ₃	Br	H	Br
1115	CH ₃	CH ₃	Br	Br	Br
1116	CH ₃	CH ₃	Br	H	F
1117	CH ₃	CH ₃	Br	CH ₃	F
1118	CH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃	F
1119	CH ₃	CH ₃	Br	Cl	F
1120	CH ₃	CH ₃	Br	Br	F
1121	CH ₃	CH ₃	Br	F	F
1122	CH ₃	CH ₃	F	H	H
1123	CH ₃	CH ₃	F	CH ₃	H
1124	CH ₃	CH ₃	F	OCH ₃	H
1125	CH ₃	CH ₃	F	Cl	H
1126	CH ₃	CH ₃	F	Br	H
1127	CH ₃	CH ₃	F	F	H

10

20

30

40

【表2-25】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1128	CH ₃	CH ₃	F	H	CH ₃
1129	CH ₃	CH ₃	F	CH ₃	CH ₃
1130	CH ₃	CH ₃	F	OCH ₃	CH ₃
1131	CH ₃	CH ₃	F	Cl	CH ₃
1132	CH ₃	CH ₃	F	Br	CH ₃
1133	CH ₃	CH ₃	F	F	CH ₃
1134	CH ₃	CH ₃	F	H	OCH ₃
1135	CH ₃	CH ₃	F	CH ₃	OCH ₃
1136	CH ₃	CH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃
1137	CH ₃	CH ₃	F	Cl	OCH ₃
1138	CH ₃	CH ₃	F	Br	OCH ₃
1139	CH ₃	CH ₃	F	F	OCH ₃
1140	CH ₃	CH ₃	F	H	Cl
1141	CH ₃	CH ₃	F	CH ₃	Cl
1142	CH ₃	CH ₃	F	OCH ₃	Cl
1143	CH ₃	CH ₃	F	Cl	Cl
1144	CH ₃	CH ₃	F	Br	Cl
1145	CH ₃	CH ₃	F	F	Cl
1146	CH ₃	CH ₃	F	H	Br
1147	CH ₃	CH ₃	F	CH ₃	Br
1148	CH ₃	CH ₃	F	OCH ₃	Br
1149	CH ₃	CH ₃	F	Cl	Br
1150	CH ₃	CH ₃	F	Br	Br
1151	CH ₃	CH ₃	F	F	Br
1152	CH ₃	CH ₃	F	H	F
1153	CH ₃	CH ₃	F	F	F
1154	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	H
1155	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	CH ₃
1156	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	OCH ₃
1157	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	Cl
1158	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	Br
1159	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	F
1160	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H
1161	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
1162	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
1163	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
1164	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
1165	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	F
1166	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
1167	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-26】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1168	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl
1169	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br
1170	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	OCH ₂	F
1171	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl	H
1172	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃
1173	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl	Cl
1174	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl	Br
1175	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl	F
1176	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br	H
1177	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃
1178	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br	Cl
1179	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br	Br
1180	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br	F
1181	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	F	H
1182	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	F	OCH ₃
1183	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	F	Cl
1184	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	F	Br
1185	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	F	F
1186	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	H
1187	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	CH ₃
1188	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	OCH ₃
1189	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	Cl
1190	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	Br
1191	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	F
1192	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
1193	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
1194	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl
1195	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br
1196	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	F
1197	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H
1198	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
1199	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
1200	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl
1201	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br
1202	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F
1203	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl	H
1204	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃
1205	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Cl
1206	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Br
1207	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl	F

10

20

30

40

【表2-27】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1208	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br	H
1209	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃
1210	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br	Cl
1211	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br	Br
1212	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br	F
1213	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F	H
1214	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F	CH ₃
1215	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F	Cl
1216	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F	Br
1217	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F	F
1218	CH ₃	OCH ₃	Cl	H	H
1219	CH ₃	OCH ₃	Cl	H	CH ₃
1220	CH ₃	OCH ₃	Cl	H	OCH ₃
1221	CH ₃	OCH ₃	Cl	H	Cl
1222	CH ₃	OCH ₃	Cl	H	Br
1223	CH ₃	OCH ₃	Cl	H	F
1224	CH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃	H
1225	CH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
1226	CH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃
1227	CH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃	Br
1228	CH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃	F
1229	CH ₃	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H
1230	CH ₃	OCH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃
1231	CH ₃	OCH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃
1232	CH ₃	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Br
1233	CH ₃	OCH ₃	Cl	OCH ₃	F
1234	CH ₃	OCH ₃	Cl	Cl	H
1235	CH ₃	OCH ₃	Cl	Cl	CH ₃
1236	CH ₃	OCH ₃	Cl	Cl	OCH ₃
1237	CH ₃	OCH ₃	Cl	Cl	Cl
1238	CH ₃	OCH ₃	Cl	Cl	Br
1239	CH ₃	OCH ₃	Cl	Cl	F
1240	CH ₃	OCH ₃	Cl	Br	H
1241	CH ₃	OCH ₃	Cl	Br	CH ₃
1242	CH ₃	OCH ₃	Cl	Br	OCH ₃
1243	CH ₃	OCH ₃	Cl	Br	Br
1244	CH ₃	OCH ₃	Cl	F	H
1245	CH ₃	OCH ₃	Cl	F	CH ₃
1246	CH ₃	OCH ₃	Cl	F	OCH ₃
1247	CH ₃	OCH ₃	Cl	F	Br

10

20

30

40

【表2-28】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1248	CH ₃	OCH ₃	Cl	F	F
1249	CH ₃	OCH ₃	Br	H	H
1250	CH ₃	OCH ₃	Br	H	CH ₃
1251	CH ₃	OCH ₃	Br	H	OCH ₃
1252	CH ₃	OCH ₃	Br	H	Cl
1253	CH ₃	OCH ₃	Br	H	Br
1254	CH ₃	OCH ₃	Br	H	F
1255	CH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃	H
1256	CH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃	CH ₃
1257	CH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃
1258	CH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃	Cl
1259	CH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃	F
1260	CH ₃	OCH ₃	Br	OCH ₃	H
1261	CH ₃	OCH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃
1262	CH ₃	OCH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃
1263	CH ₃	OCH ₃	Br	OCH ₃	Cl
1264	CH ₃	OCH ₃	Br	OCH ₃	F
1265	CH ₃	OCH ₃	Br	Cl	H
1266	CH ₃	OCH ₃	Br	Cl	CH ₃
1267	CH ₃	OCH ₃	Br	Cl	OCH ₃
1268	CH ₃	OCH ₃	Br	Cl	Cl
1269	CH ₃	OCH ₃	Br	Cl	F
1270	CH ₃	OCH ₃	Br	Br	H
1271	CH ₃	OCH ₃	Br	Br	CH ₃
1272	CH ₃	OCH ₃	Br	Br	OCH ₃
1273	CH ₃	OCH ₃	Br	Br	Cl
1274	CH ₃	OCH ₃	Br	Br	Br
1275	CH ₃	OCH ₃	Br	Br	F
1276	CH ₃	OCH ₃	Br	F	H
1277	CH ₃	OCH ₃	Br	F	CH ₃
1278	CH ₃	OCH ₃	Br	F	OCH ₃
1279	CH ₃	OCH ₃	Br	F	Cl
1280	CH ₃	OCH ₃	Br	F	F
1281	CH ₃	OCH ₃	F	H	H
1282	CH ₃	OCH ₃	F	H	CH ₃
1283	CH ₃	OCH ₃	F	H	OCH ₃
1284	CH ₃	OCH ₃	F	H	Cl
1285	CH ₃	OCH ₃	F	H	Br
1286	CH ₃	OCH ₃	F	H	F
1287	CH ₃	OCH ₃	F	CH ₃	H

10

20

30

40

【表2-29】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1288	CH ₃	OCH ₃	F	CH ₃	CH ₃
1289	CH ₃	OCH ₃	F	CH ₃	OCH ₃
1290	CH ₃	OCH ₃	F	CH ₃	Cl
1291	CH ₃	OCH ₃	F	CH ₃	Br
1292	CH ₃	OCH ₃	F	OCH ₃	H
1293	CH ₃	OCH ₃	F	OCH ₃	CH ₃
1294	CH ₃	OCH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃
1295	CH ₃	OCH ₃	F	OCH ₃	Cl
1296	CH ₃	OCH ₃	F	OCH ₃	Br
1297	CH ₃	OCH ₃	F	Cl	H
1298	CH ₃	OCH ₃	F	Cl	CH ₃
1299	CH ₃	OCH ₃	F	Cl	OCH ₃
1300	CH ₃	OCH ₃	F	Cl	Cl
1301	CH ₃	OCH ₃	F	Cl	Br
1302	CH ₃	OCH ₃	F	Br	H
1303	CH ₃	OCH ₃	F	Br	CH ₃
1304	CH ₃	OCH ₃	F	Br	OCH ₃
1305	CH ₃	OCH ₃	F	Br	Cl
1306	CH ₃	OCH ₃	F	Br	Br
1307	CH ₃	OCH ₃	F	F	H
1308	CH ₃	OCH ₃	F	F	CH ₃
1309	CH ₃	OCH ₃	F	F	OCH ₃
1310	CH ₃	OCH ₃	F	F	Cl
1311	CH ₃	OCH ₃	F	F	Br
1312	CH ₃	OCH ₃	F	F	F
1313	CH ₃	Cl	CH ₃	H	H
1314	CH ₃	Cl	CH ₃	H	CH ₃
1315	CH ₃	Cl	CH ₃	H	OCH ₃
1316	CH ₃	Cl	CH ₃	H	Cl
1317	CH ₃	Cl	CH ₃	H	Br
1318	CH ₃	Cl	CH ₃	H	F
1319	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	H
1320	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
1321	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
1322	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	Cl
1323	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	Br
1324	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	F
1325	CH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃	H
1326	CH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
1327	CH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃	Cl

10

20

30

40

【表2-30】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1328	CH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃	Br
1329	CH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃	F
1330	CH ₃	Cl	CH ₃	Cl	H
1331	CH ₃	Cl	CH ₃	Cl	OCH ₃
1332	CH ₃	Cl	CH ₃	Cl	Cl
1333	CH ₃	Cl	CH ₃	Cl	Br
1334	CH ₃	Cl	CH ₃	Cl	F
1335	CH ₃	Cl	CH ₃	Br	H
1336	CH ₃	Cl	CH ₃	Br	OCH ₃
1337	CH ₃	Cl	CH ₃	Br	Cl
1338	CH ₃	Cl	CH ₃	Br	Br
1339	CH ₃	Cl	CH ₃	Br	F
1340	CH ₃	Cl	CH ₃	F	H
1341	CH ₃	Cl	CH ₃	F	OCH ₃
1342	CH ₃	Cl	CH ₃	F	Cl
1343	CH ₃	Cl	CH ₃	F	Br
1344	CH ₃	Cl	CH ₃	F	F
1345	CH ₃	Cl	OCH ₃	H	H
1346	CH ₃	Cl	OCH ₃	H	CH ₃
1347	CH ₃	Cl	OCH ₃	H	OCH ₃
1348	CH ₃	Cl	OCH ₃	H	Cl
1349	CH ₃	Cl	OCH ₃	H	Br
1350	CH ₃	Cl	OCH ₃	H	F
1351	CH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃	H
1352	CH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
1353	CH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃	Cl
1354	CH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃	Br
1355	CH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃	F
1356	CH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃	H
1357	CH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
1358	CH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
1359	CH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Cl
1360	CH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Br
1361	CH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃	F
1362	CH ₃	Cl	OCH ₃	Cl	H
1363	CH ₃	Cl	OCH ₃	Cl	CH ₃
1364	CH ₃	Cl	OCH ₃	Cl	Cl
1365	CH ₃	Cl	OCH ₃	Cl	Br
1366	CH ₃	Cl	OCH ₃	Cl	F
1367	CH ₃	Cl	OCH ₃	Br	H

10

20

30

40

【表2-31】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1368	CH ₃	Cl	OCH ₃	Br	CH ₃
1369	CH ₃	Cl	OCH ₃	Br	Cl
1370	CH ₃	Cl	OCH ₃	Br	Br
1371	CH ₃	Cl	OCH ₃	Br	F
1372	CH ₃	Cl	OCH ₃	F	H
1373	CH ₃	Cl	OCH ₃	F	CH ₃
1374	CH ₃	Cl	OCH ₃	F	Cl
1375	CH ₃	Cl	OCH ₃	F	Br
1376	CH ₃	Cl	OCH ₃	F	F
1377	CH ₃	Cl	Cl	H	H
1378	CH ₃	Cl	Cl	H	CH ₃
1379	CH ₃	Cl	Cl	H	OCH ₃
1380	CH ₃	Cl	Cl	H	Cl
1381	CH ₃	Cl	Cl	H	Br
1382	CH ₃	Cl	Cl	H	F
1383	CH ₃	Cl	Cl	CH ₃	H
1384	CH ₃	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃
1385	CH ₃	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃
1386	CH ₃	Cl	Cl	CH ₃	Br
1387	CH ₃	Cl	Cl	CH ₃	F
1388	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H
1389	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	CH ₃
1390	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	OCH ₃
1391	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	Br
1392	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	F
1393	CH ₃	Cl	Cl	Cl	H
1394	CH ₃	Cl	Cl	Cl	CH ₃
1395	CH ₃	Cl	Cl	Cl	OCH ₃
1396	CH ₃	Cl	Cl	Cl	Cl
1397	CH ₃	Cl	Cl	Cl	Br
1398	CH ₃	Cl	Cl	Cl	F
1399	CH ₃	Cl	Cl	Br	H
1400	CH ₃	Cl	Cl	Br	CH ₃
1401	CH ₃	Cl	Cl	Br	OCH ₃
1402	CH ₃	Cl	Cl	Br	Br
1403	CH ₃	Cl	Cl	F	H
1404	CH ₃	Cl	Cl	F	CH ₃
1405	CH ₃	Cl	Cl	F	OCH ₃
1406	CH ₃	Cl	Cl	F	Br
1407	CH ₃	Cl	Cl	F	F

10

20

30

40

【表2-32】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1408	CH ₃	Cl	Br	H	H
1409	CH ₃	Cl	Br	H	CH ₃
1410	CH ₃	Cl	Br	H	OCH ₃
1411	CH ₃	Cl	Br	H	Cl
1412	CH ₃	Cl	Br	H	Br
1413	CH ₃	Cl	Br	H	F
1414	CH ₃	Cl	Br	CH ₃	H
1415	CH ₃	Cl	Br	CH ₃	CH ₃
1416	CH ₃	Cl	Br	CH ₃	OCH ₃
1417	CH ₃	Cl	Br	CH ₃	Cl
1418	CH ₃	Cl	Br	CH ₃	F
1419	CH ₃	Cl	Br	OCH ₃	H
1420	CH ₃	Cl	Br	OCH ₃	CH ₃
1421	CH ₃	Cl	Br	OCH ₃	OCH ₃
1422	CH ₃	Cl	Br	OCH ₃	Cl
1423	CH ₃	Cl	Br	OCH ₃	F
1424	CH ₃	Cl	Br	Cl	H
1425	CH ₃	Cl	Br	Cl	CH ₃
1426	CH ₃	Cl	Br	Cl	OCH ₃
1427	CH ₃	Cl	Br	Cl	Cl
1428	CH ₃	Cl	Br	Cl	F
1429	CH ₃	Cl	Br	Br	H
1430	CH ₃	Cl	Br	Br	CH ₃
1431	CH ₃	Cl	Br	Br	OCH ₃
1432	CH ₃	Cl	Br	Br	Cl
1433	CH ₃	Cl	Br	Br	Br
1434	CH ₃	Cl	Br	Br	F
1435	CH ₃	Cl	Br	F	H
1436	CH ₃	Cl	Br	F	CH ₃
1437	CH ₃	Cl	Br	F	OCH ₃
1438	CH ₃	Cl	Br	F	Cl
1439	CH ₃	Cl	Br	F	F
1440	CH ₃	Cl	F	H	H
1441	CH ₃	Cl	F	H	CH ₃
1442	CH ₃	Cl	F	H	OCH ₃
1443	CH ₃	Cl	F	H	Cl
1444	CH ₃	Cl	F	H	Br
1445	CH ₃	Cl	F	H	F
1446	CH ₃	Cl	F	CH ₃	H
1447	CH ₃	Cl	F	CH ₃	CH ₃

10

20

30

40

【表2-33】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1448	CH ₃	Cl	F	CH ₃	OCH ₃
1449	CH ₃	Cl	F	CH ₃	Cl
1450	CH ₃	Cl	F	CH ₃	Br
1451	CH ₃	Cl	F	OCH ₃	H
1452	CH ₃	Cl	F	OCH ₃	CH ₃
1453	CH ₃	Cl	F	OCH ₃	OCH ₃
1454	CH ₃	Cl	F	OCH ₃	Cl
1455	CH ₃	Cl	F	OCH ₃	Br
1456	CH ₃	Cl	F	Cl	H
1457	CH ₃	Cl	F	Cl	CH ₃
1458	CH ₃	Cl	F	Cl	OCH ₃
1459	CH ₃	Cl	F	Cl	Cl
1460	CH ₃	Cl	F	Cl	Br
1461	CH ₃	Cl	F	Br	H
1462	CH ₃	Cl	F	Br	CH ₃
1463	CH ₃	Cl	F	Br	OCH ₃
1464	CH ₃	Cl	F	Br	Cl
1465	CH ₃	Cl	F	Br	Br
1466	CH ₃	Cl	F	F	H
1467	CH ₃	Cl	F	F	CH ₃
1468	CH ₃	Cl	F	F	OCH ₃
1469	CH ₃	Cl	F	F	Cl
1470	CH ₃	Cl	F	F	Br
1471	CH ₃	Cl	F	F	F
1472	CH ₃	Br	CH ₃	H	H
1473	CH ₃	Br	CH ₃	H	CH ₃
1474	CH ₃	Br	CH ₃	H	OCH ₃
1475	CH ₃	Br	CH ₃	H	Cl
1476	CH ₃	Br	CH ₃	H	Br
1477	CH ₃	Br	CH ₃	H	F
1478	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	H
1479	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃
1480	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
1481	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	Cl
1482	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	Br
1483	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	F
1484	CH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃	H
1485	CH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
1486	CH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃	Cl
1487	CH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃	Br

10

20

30

40

【表2-34】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1488	CH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃	F
1489	CH ₃	Br	CH ₃	Cl	H
1490	CH ₃	Br	CH ₃	Cl	OCH ₃
1491	CH ₃	Br	CH ₃	Cl	Cl
1492	CH ₃	Br	CH ₃	Cl	Br
1493	CH ₃	Br	CH ₃	Cl	F
1494	CH ₃	Br	CH ₃	Br	H
1495	CH ₃	Br	CH ₃	Br	OCH ₃
1496	CH ₃	Br	CH ₃	Br	Cl
1497	CH ₃	Br	CH ₃	Br	Br
1498	CH ₃	Br	CH ₃	Br	F
1499	CH ₃	Br	CH ₃	F	H
1500	CH ₃	Br	CH ₃	F	OCH ₃
1501	CH ₃	Br	CH ₃	F	Cl
1502	CH ₃	Br	CH ₃	F	Br
1503	CH ₃	Br	CH ₃	F	F
1504	CH ₃	Br	OCH ₃	H	H
1505	CH ₃	Br	OCH ₃	H	CH ₃
1506	CH ₃	Br	OCH ₃	H	OCH ₃
1507	CH ₃	Br	OCH ₃	H	Cl
1508	CH ₃	Br	OCH ₃	H	Br
1509	CH ₃	Br	OCH ₃	H	F
1510	CH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃	H
1511	CH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
1512	CH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃	Cl
1513	CH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃	Br
1514	CH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃	F
1515	CH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃	H
1516	CH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
1517	CH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
1518	CH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃	Cl
1519	CH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃	Br
1520	CH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃	F
1521	CH ₃	Br	OCH ₃	Cl	H
1522	CH ₃	Br	OCH ₃	Cl	CH ₃
1523	CH ₃	Br	OCH ₃	Cl	Cl
1524	CH ₃	Br	OCH ₃	Cl	Br
1525	CH ₃	Br	OCH ₃	Cl	F
1526	CH ₃	Br	OCH ₃	Br	H
1527	CH ₃	Br	OCH ₃	Br	CH ₃

10

20

30

40

【表2-35】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1528	CH ₃	Br	OCH ₃	Br	Cl
1529	CH ₃	Br	OCH ₃	Br	Br
1530	CH ₃	Br	OCH ₃	Br	F
1531	CH ₃	Br	OCH ₃	F	H
1532	CH ₃	Br	OCH ₃	F	CH ₃
1533	CH ₃	Br	OCH ₃	F	Cl
1534	CH ₃	Br	OCH ₃	F	Br
1535	CH ₃	Br	OCH ₃	F	F
1536	CH ₃	Br	Cl	H	H
1537	CH ₃	Br	Cl	H	CH ₃
1538	CH ₃	Br	Cl	H	OCH ₃
1539	CH ₃	Br	Cl	H	Cl
1540	CH ₃	Br	Cl	H	Br
1541	CH ₃	Br	Cl	H	F
1542	CH ₃	Br	Cl	CH ₃	H
1543	CH ₃	Br	Cl	CH ₃	CH ₃
1544	CH ₃	Br	Cl	CH ₃	OCH ₃
1545	CH ₃	Br	Cl	CH ₃	Br
1546	CH ₃	Br	Cl	CH ₃	F
1547	CH ₃	Br	Cl	OCH ₃	H
1548	CH ₃	Br	Cl	OCH ₃	CH ₃
1549	CH ₃	Br	Cl	OCH ₃	OCH ₃
1550	CH ₃	Br	Cl	OCH ₃	Br
1551	CH ₃	Br	Cl	OCH ₃	F
1552	CH ₃	Br	Cl	Cl	H
1553	CH ₃	Br	Cl	Cl	CH ₃
1554	CH ₃	Br	Cl	Cl	OCH ₃
1555	CH ₃	Br	Cl	Cl	Cl
1556	CH ₃	Br	Cl	Cl	Br
1557	CH ₃	Br	Cl	Cl	F
1558	CH ₃	Br	Cl	Br	H
1559	CH ₃	Br	Cl	Br	CH ₃
1560	CH ₃	Br	Cl	Br	OCH ₃
1561	CH ₃	Br	Cl	Br	Br
1562	CH ₃	Br	Cl	F	H
1563	CH ₃	Br	Cl	F	CH ₃
1564	CH ₃	Br	Cl	F	OCH ₃
1565	CH ₃	Br	Cl	F	Br
1566	CH ₃	Br	Cl	F	F
1567	CH ₃	Br	Br	H	H

10

20

30

40

【表2-36】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1568	CH ₃	Br	Br	H	CH ₃
1569	CH ₃	Br	Br	H	OCH ₃
1570	CH ₃	Br	Br	H	Cl
1571	CH ₃	Br	Br	H	Br
1572	CH ₃	Br	Br	H	F
1573	CH ₃	Br	Br	CH ₃	H
1574	CH ₃	Br	Br	CH ₃	CH ₃
1575	CH ₃	Br	Br	CH ₃	OCH ₃
1576	CH ₃	Br	Br	CH ₃	Cl
1577	CH ₃	Br	Br	CH ₃	F
1578	CH ₃	Br	Br	OCH ₃	H
1579	CH ₃	Br	Br	OCH ₃	CH ₃
1580	CH ₃	Br	Br	OCH ₃	OCH ₃
1581	CH ₃	Br	Br	OCH ₃	Cl
1582	CH ₃	Br	Br	OCH ₃	F
1583	CH ₃	Br	Br	Cl	H
1584	CH ₃	Br	Br	Cl	CH ₃
1585	CH ₃	Br	Br	Cl	OCH ₃
1586	CH ₃	Br	Br	Cl	Cl
1587	CH ₃	Br	Br	Cl	F
1588	CH ₃	Br	Br	Br	H
1589	CH ₃	Br	Br	Br	CH ₃
1590	CH ₃	Br	Br	Br	OCH ₃
1591	CH ₃	Br	Br	Br	Cl
1592	CH ₃	Br	Br	Br	Br
1593	CH ₃	Br	Br	Br	F
1594	CH ₃	Br	Br	F	H
1595	CH ₃	Br	Br	F	CH ₃
1596	CH ₃	Br	Br	F	OCH ₃
1597	CH ₃	Br	Br	F	Cl
1598	CH ₃	Br	Br	F	F
1599	CH ₃	Br	F	H	H
1600	CH ₃	Br	F	H	CH ₃
1601	CH ₃	Br	F	H	OCH ₃
1602	CH ₃	Br	F	H	Cl
1603	CH ₃	Br	F	H	Br
1604	CH ₃	Br	F	H	F
1605	CH ₃	Br	F	CH ₃	H
1606	CH ₃	Br	F	CH ₃	CH ₃
1607	CH ₃	Br	F	CH ₃	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-37】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1608	CH ₃	Br	F	CH ₃	Cl
1609	CH ₃	Br	F	CH ₃	Br
1610	CH ₃	Br	F	OCH ₃	H
1611	CH ₃	Br	F	OCH ₃	CH ₃
1612	CH ₃	Br	F	OCH ₃	OCH ₃
1613	CH ₃	Br	F	OCH ₃	Cl
1614	CH ₃	Br	F	OCH ₃	Br
1615	CH ₃	Br	F	Cl	H
1616	CH ₃	Br	F	Cl	CH ₃
1617	CH ₃	Br	F	Cl	OCH ₃
1618	CH ₃	Br	F	Cl	Cl
1619	CH ₃	Br	F	Cl	Br
1620	CH ₃	Br	F	Br	H
1621	CH ₃	Br	F	Br	CH ₃
1622	CH ₃	Br	F	Br	OCH ₃
1623	CH ₃	Br	F	Br	Cl
1624	CH ₃	Br	F	Br	Br
1625	CH ₃	Br	F	F	H
1626	CH ₃	Br	F	F	CH ₃
1627	CH ₃	Br	F	F	OCH ₃
1628	CH ₃	Br	F	F	Cl
1629	CH ₃	Br	F	F	Br
1630	CH ₃	Br	F	F	F
1631	CH ₃	F	CH ₃	H	H
1632	CH ₃	F	CH ₃	H	CH ₃
1633	CH ₃	F	CH ₃	H	OCH ₃
1634	CH ₃	F	CH ₃	H	Cl
1635	CH ₃	F	CH ₃	H	Br
1636	CH ₃	F	CH ₃	H	F
1637	CH ₃	F	CH ₃	CH ₃	H
1638	CH ₃	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
1639	CH ₃	F	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
1640	CH ₃	F	CH ₃	CH ₃	Cl
1641	CH ₃	F	CH ₃	CH ₃	Br
1642	CH ₃	F	CH ₃	CH ₃	F
1643	CH ₃	F	CH ₃	OCH ₃	H
1644	CH ₃	F	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
1645	CH ₃	F	CH ₃	OCH ₃	Cl
1646	CH ₃	F	CH ₃	OCH ₃	Br
1647	CH ₃	F	CH ₃	OCH ₃	F

10

20

30

40

【表2-38】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1648	CH ₃	F	CH ₃	Cl	H
1649	CH ₃	F	CH ₃	Cl	OCH ₃
1650	CH ₃	F	CH ₃	Cl	Cl
1651	CH ₃	F	CH ₃	Cl	Br
1652	CH ₃	F	CH ₃	Cl	F
1653	CH ₃	F	CH ₃	Br	H
1654	CH ₃	F	CH ₃	Br	OCH ₃
1655	CH ₃	F	CH ₃	Br	Cl
1656	CH ₃	F	CH ₃	Br	Br
1657	CH ₃	F	CH ₃	Br	F
1658	CH ₃	F	CH ₃	F	H
1659	CH ₃	F	CH ₃	F	OCH ₃
1660	CH ₃	F	CH ₃	F	Cl
1661	CH ₃	F	CH ₃	F	Br
1662	CH ₃	F	CH ₃	F	F
1663	CH ₃	F	OCH ₃	H	H
1664	CH ₃	F	OCH ₃	H	CH ₃
1665	CH ₃	F	OCH ₃	H	OCH ₃
1666	CH ₃	F	OCH ₃	H	Cl
1667	CH ₃	F	OCH ₃	H	Br
1668	CH ₃	F	OCH ₃	H	F
1669	CH ₃	F	OCH ₃	CH ₃	H
1670	CH ₃	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
1671	CH ₃	F	OCH ₃	CH ₃	Cl
1672	CH ₃	F	OCH ₃	CH ₃	Br
1673	CH ₃	F	OCH ₃	CH ₃	F
1674	CH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃	H
1675	CH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
1676	CH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
1677	CH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃	Cl
1678	CH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃	Br
1679	CH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃	F
1680	CH ₃	F	OCH ₃	Cl	H
1681	CH ₃	F	OCH ₃	Cl	CH ₃
1682	CH ₃	F	OCH ₃	Cl	Cl
1683	CH ₃	F	OCH ₃	Cl	Br
1684	CH ₃	F	OCH ₃	Cl	F
1685	CH ₃	F	OCH ₃	Br	H
1686	CH ₃	F	OCH ₃	Br	CH ₃
1687	CH ₃	F	OCH ₃	Br	Cl

10

20

30

40

【表2-39】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1688	CH ₃	F	OCH ₃	Br	Br
1689	CH ₃	F	OCH ₃	Br	F
1690	CH ₃	F	OCH ₃	F	H
1691	CH ₃	F	OCH ₃	F	CH ₃
1692	CH ₃	F	OCH ₃	F	Cl
1693	CH ₃	F	OCH ₃	F	Br
1694	CH ₃	F	OCH ₃	F	F
1695	CH ₃	F	Cl	H	H
1696	CH ₃	F	Cl	H	CH ₃
1697	CH ₃	F	Cl	H	OCH ₃
1698	CH ₃	F	Cl	H	Cl
1699	CH ₃	F	Cl	H	Br
1700	CH ₃	F	Cl	H	F
1701	CH ₃	F	Cl	CH ₃	H
1702	CH ₃	F	Cl	CH ₃	CH ₃
1703	CH ₃	F	Cl	CH ₃	OCH ₃
1704	CH ₃	F	Cl	CH ₃	Br
1705	CH ₃	F	Cl	CH ₃	F
1706	CH ₃	F	Cl	OCH ₃	H
1707	CH ₃	F	Cl	OCH ₃	CH ₃
1708	CH ₃	F	Cl	OCH ₃	OCH ₃
1709	CH ₃	F	Cl	OCH ₃	Br
1710	CH ₃	F	Cl	OCH ₃	F
1711	CH ₃	F	Cl	Cl	H
1712	CH ₃	F	Cl	Cl	CH ₃
1713	CH ₃	F	Cl	Cl	OCH ₃
1714	CH ₃	F	Cl	Cl	Cl
1715	CH ₃	F	Cl	Cl	Br
1716	CH ₃	F	Cl	Cl	F
1717	CH ₃	F	Cl	Br	H
1718	CH ₃	F	Cl	Br	CH ₃
1719	CH ₃	F	Cl	Br	OCH ₃
1720	CH ₃	F	Cl	Br	Br
1721	CH ₃	F	Cl	F	H
1722	CH ₃	F	Cl	F	CH ₃
1723	CH ₃	F	Cl	F	OCH ₃
1724	CH ₃	F	Cl	F	Br
1725	CH ₃	F	Cl	F	F
1726	CH ₃	F	Br	H	H
1727	CH ₃	F	Br	H	CH ₃

10

20

30

40

【表2-40】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1728	CH ₃	F	Br	H	OCH ₃
1729	CH ₃	F	Br	H	Cl
1730	CH ₃	F	Br	H	Br
1731	CH ₃	F	Br	H	F
1732	CH ₃	F	Br	CH ₃	H
1733	CH ₃	F	Br	CH ₃	CH ₃
1734	CH ₃	F	Br	CH ₃	OCH ₃
1735	CH ₃	F	Br	CH ₃	Cl
1736	CH ₃	F	Br	CH ₃	F
1737	CH ₃	F	Br	OCH ₃	H
1738	CH ₃	F	Br	OCH ₃	CH ₃
1739	CH ₃	F	Br	OCH ₃	OCH ₃
1740	CH ₃	F	Br	OCH ₃	Cl
1741	CH ₃	F	Br	OCH ₃	F
1742	CH ₃	F	Br	Cl	H
1743	CH ₃	F	Br	Cl	CH ₃
1744	CH ₃	F	Br	Cl	OCH ₃
1745	CH ₃	F	Br	Cl	Cl
1746	CH ₃	F	Br	Cl	F
1747	CH ₃	F	Br	Br	H
1748	CH ₃	F	Br	Br	CH ₃
1749	CH ₃	F	Br	Br	OCH ₃
1750	CH ₃	F	Br	Br	Cl
1751	CH ₃	F	Br	Br	Br
1752	CH ₃	F	Br	Br	F
1753	CH ₃	F	Br	F	H
1754	CH ₃	F	Br	F	CH ₃
1755	CH ₃	F	Br	F	OCH ₃
1756	CH ₃	F	Br	F	Cl
1757	CH ₃	F	Br	F	F
1758	CH ₃	F	F	H	H
1759	CH ₃	F	F	H	CH ₃
1760	CH ₃	F	F	H	OCH ₃
1761	CH ₃	F	F	H	Cl
1762	CH ₃	F	F	H	Br
1763	CH ₃	F	F	H	F
1764	CH ₃	F	F	CH ₃	H
1765	CH ₃	F	F	CH ₃	CH ₃
1766	CH ₃	F	F	CH ₃	OCH ₃
1767	CH ₃	F	F	CH ₃	Cl

10

20

30

40

【表2-41】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1768	CH ₃	F	F	CH ₃	Br
1769	CH ₃	F	F	OCH ₃	H
1770	CH ₃	F	F	OCH ₃	CH ₃
1771	CH ₃	F	F	OCH ₃	OCH ₃
1772	CH ₃	F	F	OCH ₃	Cl
1773	CH ₃	F	F	OCH ₃	Br
1774	CH ₃	F	F	Cl	H
1775	CH ₃	F	F	Cl	CH ₃
1776	CH ₃	F	F	Cl	OCH ₃
1777	CH ₃	F	F	Cl	Cl
1778	CH ₃	F	F	Cl	Br
1779	CH ₃	F	F	Br	H
1780	CH ₃	F	F	Br	CH ₃
1781	CH ₃	F	F	Br	OCH ₃
1782	CH ₃	F	F	Br	Cl
1783	CH ₃	F	F	Br	Br
1784	CH ₃	F	F	F	H
1785	CH ₃	F	F	F	CH ₃
1786	CH ₃	F	F	F	OCH ₃
1787	CH ₃	F	F	F	Cl
1788	CH ₃	F	F	F	Br
1789	CH ₃	F	F	F	F
1790	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H
1791	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
1792	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
1793	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	H
1794	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	H
1795	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	F	H
1796	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
1797	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
1798	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃
1799	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
1800	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
1801	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃
1802	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃
1803	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	F	OCH ₃
1804	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Cl
1805	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
1806	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl
1807	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl

10

20

30

40

【表2-42】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1808	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	Cl
1809	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	F	Cl
1810	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Br
1811	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
1812	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br
1813	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	Br
1814	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	Br
1815	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	F	Br
1816	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	F
1817	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F
1818	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	F
1819	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	F
1820	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	F
1821	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	F	F
1822	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	H	H
1823	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
1824	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H
1825	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl	H
1826	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br	H
1827	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	F	H
1828	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	H	CH ₃
1829	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
1830	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
1831	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃
1832	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃
1833	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	F	CH ₃
1834	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	H	OCH ₃
1835	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
1836	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	H	Cl
1837	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl
1838	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl
1839	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl	Cl
1840	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br	Cl
1841	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	F	Cl
1842	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	H	Br
1843	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br
1844	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br
1845	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl	Br
1846	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br	Br
1847	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	F	Br

10

20

30

40

【表2-43】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1848	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	H	F
1849	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	F
1850	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F
1851	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl	F
1852	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br	F
1853	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	F	F
1854	OCH ₃	CH ₃	Cl	H	H
1855	OCH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃	H
1856	OCH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃	H
1857	OCH ₃	CH ₃	Cl	Cl	H
1858	OCH ₃	CH ₃	Cl	Br	H
1859	OCH ₃	CH ₃	Cl	F	H
1860	OCH ₃	CH ₃	Cl	H	CH ₃
1861	OCH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
1862	OCH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃
1863	OCH ₃	CH ₃	Cl	Cl	CH ₃
1864	OCH ₃	CH ₃	Cl	Br	CH ₃
1865	OCH ₃	CH ₃	Cl	F	CH ₃
1866	OCH ₃	CH ₃	Cl	H	OCH ₃
1867	OCH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃
1868	OCH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃
1869	OCH ₃	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃
1870	OCH ₃	CH ₃	Cl	Br	OCH ₃
1871	OCH ₃	CH ₃	Cl	F	OCH ₃
1872	OCH ₃	CH ₃	Cl	H	Cl
1873	OCH ₃	CH ₃	Cl	Cl	Cl
1874	OCH ₃	CH ₃	Cl	H	Br
1875	OCH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃	Br
1876	OCH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃	Br
1877	OCH ₃	CH ₃	Cl	Cl	Br
1878	OCH ₃	CH ₃	Cl	Br	Br
1879	OCH ₃	CH ₃	Cl	F	Br
1880	OCH ₃	CH ₃	Cl	H	F
1881	OCH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃	F
1882	OCH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃	F
1883	OCH ₃	CH ₃	Cl	Cl	F
1884	OCH ₃	CH ₃	Cl	F	F
1885	OCH ₃	CH ₃	Br	H	H
1886	OCH ₃	CH ₃	Br	CH ₃	H
1887	OCH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃	H

10

20

30

40

【表2-44】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1888	OCH ₃	CH ₃	Br	Cl	H
1889	OCH ₃	CH ₃	Br	Br	H
1890	OCH ₃	CH ₃	Br	F	H
1891	OCH ₃	CH ₃	Br	H	CH ₃
1892	OCH ₃	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃
1893	OCH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃
1894	OCH ₃	CH ₃	Br	Cl	CH ₃
1895	OCH ₃	CH ₃	Br	Br	CH ₃
1896	OCH ₃	CH ₃	Br	F	CH ₃
1897	OCH ₃	CH ₃	Br	H	OCH ₃
1898	OCH ₃	CH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃
1899	OCH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃
1900	OCH ₃	CH ₃	Br	Cl	OCH ₃
1901	OCH ₃	CH ₃	Br	Br	OCH ₃
1902	OCH ₃	CH ₃	Br	F	OCH ₃
1903	OCH ₃	CH ₃	Br	H	Cl
1904	OCH ₃	CH ₃	Br	CH ₃	Cl
1905	OCH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃	Cl
1906	OCH ₃	CH ₃	Br	Cl	Cl
1907	OCH ₃	CH ₃	Br	Br	Cl
1908	OCH ₃	CH ₃	Br	F	Cl
1909	OCH ₃	CH ₃	Br	H	Br
1910	OCH ₃	CH ₃	Br	Br	Br
1911	OCH ₃	CH ₃	Br	H	F
1912	OCH ₃	CH ₃	Br	CH ₃	F
1913	OCH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃	F
1914	OCH ₃	CH ₃	Br	Cl	F
1915	OCH ₃	CH ₃	Br	Br	F
1916	OCH ₃	CH ₃	Br	F	F
1917	OCH ₃	CH ₃	F	H	H
1918	OCH ₃	CH ₃	F	CH ₃	H
1919	OCH ₃	CH ₃	F	OCH ₃	H
1920	OCH ₃	CH ₃	F	Cl	H
1921	OCH ₃	CH ₃	F	Br	H
1922	OCH ₃	CH ₃	F	F	H
1923	OCH ₃	CH ₃	F	H	CH ₃
1924	OCH ₃	CH ₃	F	CH ₃	CH ₃
1925	OCH ₃	CH ₃	F	OCH ₃	CH ₃
1926	OCH ₃	CH ₃	F	Cl	CH ₃
1927	OCH ₃	CH ₃	F	Br	CH ₃

10

20

30

40

【表2-45】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1928	OCH ₃	CH ₃	F	F	CH ₃
1929	OCH ₃	CH ₃	F	H	OCH ₃
1930	OCH ₃	CH ₃	F	CH ₃	OCH ₃
1931	OCH ₃	CH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃
1932	OCH ₃	CH ₃	F	Cl	OCH ₃
1933	OCH ₃	CH ₃	F	Br	OCH ₃
1934	OCH ₃	CH ₃	F	F	OCH ₃
1935	OCH ₃	CH ₃	F	H	Cl
1936	OCH ₃	CH ₃	F	CH ₃	Cl
1937	OCH ₃	CH ₃	F	OCH ₃	Cl
1938	OCH ₃	CH ₃	F	Cl	Cl
1939	OCH ₃	CH ₃	F	Br	Cl
1940	OCH ₃	CH ₃	F	F	Cl
1941	OCH ₃	CH ₃	F	H	Br
1942	OCH ₃	CH ₃	F	CH ₃	Br
1943	OCH ₃	CH ₃	F	OCH ₃	Br
1944	OCH ₃	CH ₃	F	Cl	Br
1945	OCH ₃	CH ₃	F	Br	Br
1946	OCH ₃	CH ₃	F	F	Br
1947	OCH ₃	CH ₃	F	H	F
1948	OCH ₃	CH ₃	F	F	F
1949	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	H
1950	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	CH ₃
1951	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	OCH ₃
1952	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	Cl
1953	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	Br
1954	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	F
1955	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H
1956	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
1957	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
1958	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
1959	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
1960	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	F
1961	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
1962	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
1963	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl
1964	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br
1965	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	F
1966	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl	H
1967	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-46】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
1968	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl	Cl
1969	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl	Br
1970	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl	F
1971	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br	H
1972	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃
1973	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br	Cl
1974	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br	Br
1975	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br	F
1976	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	F	H
1977	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	F	OCH ₃
1978	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	F	Cl
1979	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	F	Br
1980	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	F	F
1981	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	H
1982	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	CH ₃
1983	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	OCH ₃
1984	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	Cl
1985	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	Br
1986	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H	F
1987	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
1988	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
1989	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl
1990	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br
1991	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	F
1992	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H
1993	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
1994	OCH ₃				
1995	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl
1996	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br
1997	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F
1998	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl	H
1999	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃
2000	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Cl
2001	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Br
2002	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl	F
2003	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br	H
2004	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃
2005	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br	Cl
2006	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br	Br
2007	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br	F

10

20

30

40

【表2-47】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2008	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F	H
2009	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F	CH ₃
2010	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F	Cl
2011	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F	Br
2012	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F	F
2013	OCH ₃	OCH ₃	Cl	H	H
2014	OCH ₃	OCH ₃	Cl	H	CH ₃
2015	OCH ₃	OCH ₃	Cl	H	OCH ₃
2016	OCH ₃	OCH ₃	Cl	H	Cl
2017	OCH ₃	OCH ₃	Cl	H	Br
2018	OCH ₃	OCH ₃	Cl	H	F
2019	OCH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃	H
2020	OCH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
2021	OCH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃
2022	OCH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃	Br
2023	OCH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃	F
2024	OCH ₃	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H
2025	OCH ₃	OCH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃
2026	OCH ₃	OCH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃
2027	OCH ₃	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Br
2028	OCH ₃	OCH ₃	Cl	OCH ₃	F
2029	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Cl	H
2030	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Cl	CH ₃
2031	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Cl	OCH ₃
2032	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Cl	Cl
2033	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Cl	Br
2034	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Cl	F
2035	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Br	H
2036	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Br	CH ₃
2037	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Br	OCH ₃
2038	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Br	Br
2039	OCH ₃	OCH ₃	Cl	F	H
2040	OCH ₃	OCH ₃	Cl	F	CH ₃
2041	OCH ₃	OCH ₃	Cl	F	OCH ₃
2042	OCH ₃	OCH ₃	Cl	F	Br
2043	OCH ₃	OCH ₃	Cl	F	F
2044	OCH ₃	OCH ₃	Br	H	H
2045	OCH ₃	OCH ₃	Br	H	CH ₃
2046	OCH ₃	OCH ₃	Br	H	OCH ₃
2047	OCH ₃	OCH ₃	Br	H	Cl

10

20

30

40

【表2-48】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2048	OCH ₃	OCH ₃	Br	H	Br
2049	OCH ₃	OCH ₃	Br	H	F
2050	OCH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃	H
2051	OCH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃	CH ₃
2052	OCH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃
2053	OCH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃	Cl
2054	OCH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃	F
2055	OCH ₃	OCH ₃	Br	OCH ₃	H
2056	OCH ₃	OCH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃
2057	OCH ₃	OCH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃
2058	OCH ₃	OCH ₃	Br	OCH ₃	Cl
2059	OCH ₃	OCH ₃	Br	OCH ₃	F
2060	OCH ₃	OCH ₃	Br	Cl	H
2061	OCH ₃	OCH ₃	Br	Cl	CH ₃
2062	OCH ₃	OCH ₃	Br	Cl	OCH ₃
2063	OCH ₃	OCH ₃	Br	Cl	Cl
2064	OCH ₃	OCH ₃	Br	Cl	F
2065	OCH ₃	OCH ₃	Br	Br	H
2066	OCH ₃	OCH ₃	Br	Br	CH ₃
2067	OCH ₃	OCH ₃	Br	Br	OCH ₃
2068	OCH ₃	OCH ₃	Br	Br	Cl
2069	OCH ₃	OCH ₃	Br	Br	Br
2070	OCH ₃	OCH ₃	Br	Br	F
2071	OCH ₃	OCH ₃	Br	F	H
2072	OCH ₃	OCH ₃	Br	F	CH ₃
2073	OCH ₃	OCH ₃	Br	F	OCH ₃
2074	OCH ₃	OCH ₃	Br	F	Cl
2075	OCH ₃	OCH ₃	Br	F	F
2076	OCH ₃	OCH ₃	F	H	H
2077	OCH ₃	OCH ₃	F	H	CH ₃
2078	OCH ₃	OCH ₃	F	H	OCH ₃
2079	OCH ₃	OCH ₃	F	H	Cl
2080	OCH ₃	OCH ₃	F	H	Br
2081	OCH ₃	OCH ₃	F	H	F
2082	OCH ₃	OCH ₃	F	CH ₃	H
2083	OCH ₃	OCH ₃	F	CH ₃	CH ₃
2084	OCH ₃	OCH ₃	F	CH ₃	OCH ₃
2085	OCH ₃	OCH ₃	F	CH ₃	Cl
2086	OCH ₃	OCH ₃	F	CH ₃	Br
2087	OCH ₃	OCH ₃	F	OCH ₃	H

10

20

30

40

【表2-49】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2088	OCH ₃	OCH ₃	F	OCH ₃	CH ₃
2089	OCH ₃	OCH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃
2090	OCH ₃	OCH ₃	F	OCH ₃	Cl
2091	OCH ₃	OCH ₃	F	OCH ₃	Br
2092	OCH ₃	OCH ₃	F	Cl	H
2093	OCH ₃	OCH ₃	F	Cl	CH ₃
2094	OCH ₃	OCH ₃	F	Cl	OCH ₃
2095	OCH ₃	OCH ₃	F	Cl	Cl
2096	OCH ₃	OCH ₃	F	Cl	Br
2097	OCH ₃	OCH ₃	F	Br	H
2098	OCH ₃	OCH ₃	F	Br	CH ₃
2099	OCH ₃	OCH ₃	F	Br	OCH ₃
2100	OCH ₃	OCH ₃	F	Br	Cl
2101	OCH ₃	OCH ₃	F	Br	Br
2102	OCH ₃	OCH ₃	F	F	H
2103	OCH ₃	OCH ₃	F	F	CH ₃
2104	OCH ₃	OCH ₃	F	F	OCH ₃
2105	OCH ₃	OCH ₃	F	F	Cl
2106	OCH ₃	OCH ₃	F	F	Br
2107	OCH ₃	OCH ₃	F	F	F
2108	OCH ₃	Cl	CH ₃	H	H
2109	OCH ₃	Cl	CH ₃	H	CH ₃
2110	OCH ₃	Cl	CH ₃	H	OCH ₃
2111	OCH ₃	Cl	CH ₃	H	Cl
2112	OCH ₃	Cl	CH ₃	H	Br
2113	OCH ₃	Cl	CH ₃	H	F
2114	OCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	H
2115	OCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
2116	OCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
2117	OCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	Cl
2118	OCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	Br
2119	OCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	F
2120	OCH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃	H
2121	OCH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
2122	OCH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃	Cl
2123	OCH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃	Br
2124	OCH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃	F
2125	OCH ₃	Cl	CH ₃	Cl	H
2126	OCH ₃	Cl	CH ₃	Cl	OCH ₃
2127	OCH ₃	Cl	CH ₃	Cl	Cl

10

20

30

40

【表2-50】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2128	OCH ₃	Cl	CH ₃	Cl	Br
2129	OCH ₃	Cl	CH ₃	Cl	F
2130	OCH ₃	Cl	CH ₃	Br	H
2131	OCH ₃	Cl	CH ₃	Br	OCH ₃
2132	OCH ₃	Cl	CH ₃	Br	Cl
2133	OCH ₃	Cl	CH ₃	Br	Br
2134	OCH ₃	Cl	CH ₃	Br	F
2135	OCH ₃	Cl	CH ₃	F	H
2136	OCH ₃	Cl	CH ₃	F	OCH ₃
2137	OCH ₃	Cl	CH ₃	F	Cl
2138	OCH ₃	Cl	CH ₃	F	Br
2139	OCH ₃	Cl	CH ₃	F	F
2140	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H	H
2141	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H	CH ₃
2142	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H	OCH ₃
2143	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H	Cl
2144	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H	Br
2145	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H	F
2146	OCH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃	H
2147	OCH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
2148	OCH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃	Cl
2149	OCH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃	Br
2150	OCH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃	F
2151	OCH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃	H
2152	OCH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
2153	OCH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
2154	OCH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Cl
2155	OCH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Br
2156	OCH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃	F
2157	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Cl	H
2158	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Cl	CH ₃
2159	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Cl	Cl
2160	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Cl	Br
2161	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Cl	F
2162	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Br	H
2163	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Br	CH ₃
2164	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Br	Cl
2165	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Br	Br
2166	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Br	F
2167	OCH ₃	Cl	OCH ₃	F	H

10

20

30

40

【表2-51】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2168	OCH ₃	Cl	OCH ₃	F	CH ₃
2169	OCH ₃	Cl	OCH ₃	F	Cl
2170	OCH ₃	Cl	OCH ₃	F	Br
2171	OCH ₃	Cl	OCH ₃	F	F
2172	OCH ₃	Cl	Cl	H	H
2173	OCH ₃	Cl	Cl	H	CH ₃
2174	OCH ₃	Cl	Cl	H	OCH ₃
2175	OCH ₃	Cl	Cl	H	Cl
2176	OCH ₃	Cl	Cl	H	Br
2177	OCH ₃	Cl	Cl	H	F
2178	OCH ₃	Cl	Cl	CH ₃	H
2179	OCH ₃	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃
2180	OCH ₃	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃
2181	OCH ₃	Cl	Cl	CH ₃	Br
2182	OCH ₃	Cl	Cl	CH ₃	F
2183	OCH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	H
2184	OCH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	CH ₃
2185	OCH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	OCH ₃
2186	OCH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	Br
2187	OCH ₃	Cl	Cl	OCH ₃	F
2188	OCH ₃	Cl	Cl	Cl	H
2189	OCH ₃	Cl	Cl	Cl	CH ₃
2190	OCH ₃	Cl	Cl	Cl	OCH ₃
2191	OCH ₃	Cl	Cl	Cl	Cl
2192	OCH ₃	Cl	Cl	Cl	Br
2193	OCH ₃	Cl	Cl	Cl	F
2194	OCH ₃	Cl	Cl	Br	H
2195	OCH ₃	Cl	Cl	Br	CH ₃
2196	OCH ₃	Cl	Cl	Br	OCH ₃
2197	OCH ₃	Cl	Cl	Br	Br
2198	OCH ₃	Cl	Cl	F	H
2199	OCH ₃	Cl	Cl	F	CH ₃
2200	OCH ₃	Cl	Cl	F	OCH ₃
2201	OCH ₃	Cl	Cl	F	Br
2202	OCH ₃	Cl	Cl	F	F
2203	OCH ₃	Cl	Br	H	H
2204	OCH ₃	Cl	Br	H	CH ₃
2205	OCH ₃	Cl	Br	H	OCH ₃
2206	OCH ₃	Cl	Br	H	Cl
2207	OCH ₃	Cl	Br	H	Br

10

20

30

40

【表2-52】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2208	OCH ₃	Cl	Br	H	F
2209	OCH ₃	Cl	Br	CH ₃	H
2210	OCH ₃	Cl	Br	CH ₃	CH ₃
2211	OCH ₃	Cl	Br	CH ₃	OCH ₃
2212	OCH ₃	Cl	Br	CH ₃	Cl
2213	OCH ₃	Cl	Br	CH ₃	F
2214	OCH ₃	Cl	Br	OCH ₃	H
2215	OCH ₃	Cl	Br	OCH ₃	CH ₃
2216	OCH ₃	Cl	Br	OCH ₃	OCH ₃
2217	OCH ₃	Cl	Br	OCH ₃	Cl
2218	OCH ₃	Cl	Br	OCH ₃	F
2219	OCH ₃	Cl	Br	Cl	H
2220	OCH ₃	Cl	Br	Cl	CH ₃
2221	OCH ₃	Cl	Br	Cl	OCH ₃
2222	OCH ₃	Cl	Br	Cl	Cl
2223	OCH ₃	Cl	Br	Cl	F
2224	OCH ₃	Cl	Br	Br	H
2225	OCH ₃	Cl	Br	Br	CH ₃
2226	OCH ₃	Cl	Br	Br	OCH ₃
2227	OCH ₃	Cl	Br	Br	Cl
2228	OCH ₃	Cl	Br	Br	Br
2229	OCH ₃	Cl	Br	Br	F
2230	OCH ₃	Cl	Br	F	H
2231	OCH ₃	Cl	Br	F	CH ₃
2232	OCH ₃	Cl	Br	F	OCH ₃
2233	OCH ₃	Cl	Br	F	Cl
2234	OCH ₃	Cl	Br	F	F
2235	OCH ₃	Cl	F	H	H
2236	OCH ₃	Cl	F	H	CH ₃
2237	OCH ₃	Cl	F	H	OCH ₃
2238	OCH ₃	Cl	F	H	Cl
2239	OCH ₃	Cl	F	H	Br
2240	OCH ₃	Cl	F	H	F
2241	OCH ₃	Cl	F	CH ₃	H
2242	OCH ₃	Cl	F	CH ₃	CH ₃
2243	OCH ₃	Cl	F	CH ₃	OCH ₃
2244	OCH ₃	Cl	F	CH ₃	Cl
2245	OCH ₃	Cl	F	CH ₃	Br
2246	OCH ₃	Cl	F	OCH ₃	H
2247	OCH ₃	Cl	F	OCH ₃	CH ₃

10

20

30

40

【表2-53】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2248	OCH ₃	Cl	F	OCH ₃	OCH ₃
2249	OCH ₃	Cl	F	OCH ₃	Cl
2250	OCH ₃	Cl	F	OCH ₃	Br
2251	OCH ₃	Cl	F	Cl	H
2252	OCH ₃	Cl	F	Cl	CH ₃
2253	OCH ₃	Cl	F	Cl	OCH ₃
2254	OCH ₃	Cl	F	Cl	Cl
2255	OCH ₃	Cl	F	Cl	Br
2256	OCH ₃	Cl	F	Br	H
2257	OCH ₃	Cl	F	Br	CH ₃
2258	OCH ₃	Cl	F	Br	OCH ₃
2259	OCH ₃	Cl	F	Br	Cl
2260	OCH ₃	Cl	F	Br	Br
2261	OCH ₃	Cl	F	F	H
2262	OCH ₃	Cl	F	F	CH ₃
2263	OCH ₃	Cl	F	F	OCH ₃
2264	OCH ₃	Cl	F	F	Cl
2265	OCH ₃	Cl	F	F	Br
2266	OCH ₃	Cl	F	F	F
2267	OCH ₃	Br	CH ₃	H	H
2268	OCH ₃	Br	CH ₃	H	CH ₃
2269	OCH ₃	Br	CH ₃	H	OCH ₃
2270	OCH ₃	Br	CH ₃	H	Cl
2271	OCH ₃	Br	CH ₃	H	Br
2272	OCH ₃	Br	CH ₃	H	F
2273	OCH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	H
2274	OCH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃
2275	OCH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
2276	OCH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	Cl
2277	OCH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	Br
2278	OCH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	F
2279	OCH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃	H
2280	OCH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
2281	OCH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃	Cl
2282	OCH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃	Br
2283	OCH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃	F
2284	OCH ₃	Br	CH ₃	Cl	H
2285	OCH ₃	Br	CH ₃	Cl	OCH ₃
2286	OCH ₃	Br	CH ₃	Cl	Cl
2287	OCH ₃	Br	CH ₃	Cl	Br

10

20

30

40

【表2-54】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2288	OCH ₃	Br	CH ₃	Cl	F
2289	OCH ₃	Br	CH ₃	Br	H
2290	OCH ₃	Br	CH ₃	Br	OCH ₃
2291	OCH ₃	Br	CH ₃	Br	Cl
2292	OCH ₃	Br	CH ₃	Br	Br
2293	OCH ₃	Br	CH ₃	Br	F
2294	OCH ₃	Br	CH ₃	F	H
2295	OCH ₃	Br	CH ₃	F	OCH ₃
2296	OCH ₃	Br	CH ₃	F	Cl
2297	OCH ₃	Br	CH ₃	F	Br
2298	OCH ₃	Br	CH ₃	F	F
2299	OCH ₃	Br	OCH ₃	H	H
2300	OCH ₃	Br	OCH ₃	H	CH ₃
2301	OCH ₃	Br	OCH ₃	H	OCH ₃
2302	OCH ₃	Br	OCH ₃	H	Cl
2303	OCH ₃	Br	OCH ₃	H	Br
2304	OCH ₃	Br	OCH ₃	H	F
2305	OCH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃	H
2306	OCH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
2307	OCH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃	Cl
2308	OCH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃	Br
2309	OCH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃	F
2310	OCH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃	H
2311	OCH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
2312	OCH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
2313	OCH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃	Cl
2314	OCH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃	Br
2315	OCH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃	F
2316	OCH ₃	Br	OCH ₃	Cl	H
2317	OCH ₃	Br	OCH ₃	Cl	CH ₃
2318	OCH ₃	Br	OCH ₃	Cl	Cl
2319	OCH ₃	Br	OCH ₃	Cl	Br
2320	OCH ₃	Br	OCH ₃	Cl	F
2321	OCH ₃	Br	OCH ₃	Br	H
2322	OCH ₃	Br	OCH ₃	Br	CH ₃
2323	OCH ₃	Br	OCH ₃	Br	Cl
2324	OCH ₃	Br	OCH ₃	Br	Br
2325	OCH ₃	Br	OCH ₃	Br	F
2326	OCH ₃	Br	OCH ₃	F	H
2327	OCH ₃	Br	OCH ₃	F	CH ₃

10

20

30

40

【表2-55】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2328	OCH ₃	Br	OCH ₃	F	Cl
2329	OCH ₃	Br	OCH ₃	F	Br
2330	OCH ₃	Br	OCH ₃	F	F
2331	OCH ₃	Br	Cl	H	H
2332	OCH ₃	Br	Cl	H	CH ₃
2333	OCH ₃	Br	Cl	H	OCH ₃
2334	OCH ₃	Br	Cl	H	Cl
2335	OCH ₃	Br	Cl	H	Br
2336	OCH ₃	Br	Cl	H	F
2337	OCH ₃	Br	Cl	CH ₃	H
2338	OCH ₃	Br	Cl	CH ₃	CH ₃
2339	OCH ₃	Br	Cl	CH ₃	OCH ₃
2340	OCH ₃	Br	Cl	CH ₃	Br
2341	OCH ₃	Br	Cl	CH ₃	F
2342	OCH ₃	Br	Cl	OCH ₃	H
2343	OCH ₃	Br	Cl	OCH ₃	CH ₃
2344	OCH ₃	Br	Cl	OCH ₃	OCH ₃
2345	OCH ₃	Br	Cl	OCH ₃	Br
2346	OCH ₃	Br	Cl	OCH ₃	F
2347	OCH ₃	Br	Cl	Cl	H
2348	OCH ₃	Br	Cl	Cl	CH ₃
2349	OCH ₃	Br	Cl	Cl	OCH ₃
2350	OCH ₃	Br	Cl	Cl	Cl
2351	OCH ₃	Br	Cl	Cl	Br
2352	OCH ₃	Br	Cl	Cl	F
2353	OCH ₃	Br	Cl	Br	H
2354	OCH ₃	Br	Cl	Br	CH ₃
2355	OCH ₃	Br	Cl	Br	OCH ₃
2356	OCH ₃	Br	Cl	Br	Br
2357	OCH ₃	Br	Cl	F	H
2358	OCH ₃	Br	Cl	F	CH ₃
2359	OCH ₃	Br	Cl	F	OCH ₃
2360	OCH ₃	Br	Cl	F	Br
2361	OCH ₃	Br	Cl	F	F
2362	OCH ₃	Br	Br	H	H
2363	OCH ₃	Br	Br	H	CH ₃
2364	OCH ₃	Br	Br	H	OCH ₃
2365	OCH ₃	Br	Br	H	Cl
2366	OCH ₃	Br	Br	H	Br
2367	OCH ₃	Br	Br	H	F

10

20

30

40

【表2-56】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2368	OCH ₃	Br	Br	CH ₃	H
2369	OCH ₃	Br	Br	CH ₃	CH ₃
2370	OCH ₃	Br	Br	CH ₃	OCH ₃
2371	OCH ₃	Br	Br	CH ₃	Cl
2372	OCH ₃	Br	Br	CH ₃	F
2373	OCH ₃	Br	Br	OCH ₃	H
2374	OCH ₃	Br	Br	OCH ₃	CH ₃
2375	OCH ₃	Br	Br	OCH ₃	OCH ₃
2376	OCH ₃	Br	Br	OCH ₃	Cl
2377	OCH ₃	Br	Br	OCH ₃	F
2378	OCH ₃	Br	Br	Cl	H
2379	OCH ₃	Br	Br	Cl	CH ₃
2380	OCH ₃	Br	Br	Cl	OCH ₃
2381	OCH ₃	Br	Br	Cl	Cl
2382	OCH ₃	Br	Br	Cl	F
2383	OCH ₃	Br	Br	Br	H
2384	OCH ₃	Br	Br	Br	CH ₃
2385	OCH ₃	Br	Br	Br	OCH ₃
2386	OCH ₃	Br	Br	Br	Cl
2387	OCH ₃	Br	Br	Br	Br
2388	OCH ₃	Br	Br	Br	F
2389	OCH ₃	Br	Br	F	H
2390	OCH ₃	Br	Br	F	CH ₃
2391	OCH ₃	Br	Br	F	OCH ₃
2392	OCH ₃	Br	Br	F	Cl
2393	OCH ₃	Br	Br	F	F
2394	OCH ₃	Br	F	H	H
2395	OCH ₃	Br	F	H	CH ₃
2396	OCH ₃	Br	F	H	OCH ₃
2397	OCH ₃	Br	F	H	Cl
2398	OCH ₃	Br	F	H	Br
2399	OCH ₃	Br	F	H	F
2400	OCH ₃	Br	F	CH ₃	H
2401	OCH ₃	Br	F	CH ₃	CH ₃
2402	OCH ₃	Br	F	CH ₃	OCH ₃
2403	OCH ₃	Br	F	CH ₃	Cl
2404	OCH ₃	Br	F	CH ₃	Br
2405	OCH ₃	Br	F	OCH ₃	H
2406	OCH ₃	Br	F	OCH ₃	CH ₃
2407	OCH ₃	Br	F	OCH ₃	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-57】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2408	OCH ₃	Br	F	OCH ₃	Cl
2409	OCH ₃	Br	F	OCH ₃	Br
2410	OCH ₃	Br	F	Cl	H
2411	OCH ₃	Br	F	Cl	CH ₃
2412	OCH ₃	Br	F	Cl	OCH ₃
2413	OCH ₃	Br	F	Cl	Cl
2414	OCH ₃	Br	F	Cl	Br
2415	OCH ₃	Br	F	Br	H
2416	OCH ₃	Br	F	Br	CH ₃
2417	OCH ₃	Br	F	Br	OCH ₃
2418	OCH ₃	Br	F	Br	Cl
2419	OCH ₃	Br	F	Br	Br
2420	OCH ₃	Br	F	F	H
2421	OCH ₃	Br	F	F	CH ₃
2422	OCH ₃	Br	F	F	OCH ₃
2423	OCH ₃	Br	F	F	Cl
2424	OCH ₃	Br	F	F	Br
2425	OCH ₃	Br	F	F	F
2426	OCH ₃	F	CH ₃	H	H
2427	OCH ₃	F	CH ₃	H	CH ₃
2428	OCH ₃	F	CH ₃	H	OCH ₃
2429	OCH ₃	F	CH ₃	H	Cl
2430	OCH ₃	F	CH ₃	H	Br
2431	OCH ₃	F	CH ₃	H	F
2432	OCH ₃	F	CH ₃	CH ₃	H
2433	OCH ₃	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
2434	OCH ₃	F	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
2435	OCH ₃	F	CH ₃	CH ₃	Cl
2436	OCH ₃	F	CH ₃	CH ₃	Br
2437	OCH ₃	F	CH ₃	CH ₃	F
2438	OCH ₃	F	CH ₃	OCH ₃	H
2439	OCH ₃	F	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
2440	OCH ₃	F	CH ₃	OCH ₃	Cl
2441	OCH ₃	F	CH ₃	OCH ₃	Br
2442	OCH ₃	F	CH ₃	OCH ₃	F
2443	OCH ₃	F	CH ₃	Cl	H
2444	OCH ₃	F	CH ₃	Cl	OCH ₃
2445	OCH ₃	F	CH ₃	Cl	Cl
2446	OCH ₃	F	CH ₃	Cl	Br
2447	OCH ₃	F	CH ₃	Cl	F

10

20

30

40

【表2-58】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2448	OCH ₃	F	CH ₃	Br	H
2449	OCH ₃	F	CH ₃	Br	OCH ₃
2450	OCH ₃	F	CH ₃	Br	Cl
2451	OCH ₃	F	CH ₃	Br	Br
2452	OCH ₃	F	CH ₃	Br	F
2453	OCH ₃	F	CH ₃	F	H
2454	OCH ₃	F	CH ₃	F	OCH ₃
2455	OCH ₃	F	CH ₃	F	Cl
2456	OCH ₃	F	CH ₃	F	Br
2457	OCH ₃	F	CH ₃	F	F
2458	OCH ₃	F	OCH ₃	H	H
2459	OCH ₃	F	OCH ₃	H	CH ₃
2460	OCH ₃	F	OCH ₃	H	OCH ₃
2461	OCH ₃	F	OCH ₂	H	Cl
2462	OCH ₃	F	OCH ₃	H	Br
2463	OCH ₃	F	OCH ₃	H	F
2464	OCH ₃	F	OCH ₃	CH ₃	H
2465	OCH ₃	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
2466	OCH ₃	F	OCH ₃	CH ₃	Cl
2467	OCH ₃	F	OCH ₃	CH ₃	Br
2468	OCH ₃	F	OCH ₃	CH ₃	F
2469	OCH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃	H
2470	OCH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
2471	OCH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
2472	OCH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃	Cl
2473	OCH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃	Br
2474	OCH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃	F
2475	OCH ₃	F	OCH ₃	Cl	H
2476	OCH ₃	F	OCH ₃	Cl	CH ₃
2477	OCH ₃	F	OCH ₃	Cl	Cl
2478	OCH ₃	F	OCH ₃	Cl	Br
2479	OCH ₃	F	OCH ₃	Cl	F
2480	OCH ₃	F	OCH ₃	Br	H
2481	OCH ₃	F	OCH ₃	Br	CH ₃
2482	OCH ₃	F	OCH ₃	Br	Cl
2483	OCH ₃	F	OCH ₃	Br	Br
2484	OCH ₃	F	OCH ₃	Br	F
2485	OCH ₃	F	OCH ₃	F	H
2486	OCH ₃	F	OCH ₃	F	CH ₃
2487	OCH ₃	F	OCH ₃	F	Cl

10

20

30

40

【表2-59】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2488	OCH ₃	F	OCH ₃	F	Br
2489	OCH ₃	F	OCH ₃	F	F
2490	OCH ₃	F	Cl	H	H
2491	OCH ₃	F	Cl	H	CH ₃
2492	OCH ₃	F	Cl	H	OCH ₃
2493	OCH ₃	F	Cl	H	Cl
2494	OCH ₃	F	Cl	H	Br
2495	OCH ₃	F	Cl	H	F
2496	OCH ₃	F	Cl	CH ₃	H
2497	OCH ₃	F	Cl	CH ₃	CH ₃
2498	OCH ₃	F	Cl	CH ₃	OCH ₃
2499	OCH ₃	F	Cl	CH ₃	Br
2500	OCH ₃	F	Cl	CH ₃	F
2501	OCH ₃	F	Cl	OCH ₃	H
2502	OCH ₃	F	Cl	OCH ₃	CH ₃
2503	OCH ₃	F	Cl	OCH ₃	OCH ₃
2504	OCH ₃	F	Cl	OCH ₃	Br
2505	OCH ₃	F	Cl	OCH ₃	F
2506	OCH ₃	F	Cl	Cl	H
2507	OCH ₃	F	Cl	Cl	CH ₃
2508	OCH ₃	F	Cl	Cl	OCH ₃
2509	OCH ₃	F	Cl	Cl	Cl
2510	OCH ₃	F	Cl	Cl	Br
2511	OCH ₃	F	Cl	Cl	F
2512	OCH ₃	F	Cl	Br	H
2513	OCH ₃	F	Cl	Br	CH ₃
2514	OCH ₃	F	Cl	Br	OCH ₃
2515	OCH ₃	F	Cl	Br	Br
2516	OCH ₃	F	Cl	F	H
2517	OCH ₃	F	Cl	F	CH ₃
2518	OCH ₃	F	Cl	F	OCH ₃
2519	OCH ₃	F	Cl	F	Br
2520	OCH ₃	F	Cl	F	F
2521	OCH ₃	F	Br	H	H
2522	OCH ₃	F	Br	H	CH ₃
2523	OCH ₃	F	Br	H	OCH ₃
2524	OCH ₃	F	Br	H	Cl
2525	OCH ₃	F	Br	H	Br
2526	OCH ₃	F	Br	H	F
2527	OCH ₃	F	Br	CH ₃	H

10

20

30

40

【表2-60】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2528	OCH ₃	F	Br	CH ₃	CH ₃
2529	OCH ₃	F	Br	CH ₃	OCH ₃
2530	OCH ₃	F	Br	CH ₃	Cl
2531	OCH ₃	F	Br	CH ₃	F
2532	OCH ₃	F	Br	OCH ₃	H
2533	OCH ₃	F	Br	OCH ₃	CH ₃
2534	OCH ₃	F	Br	OCH ₃	OCH ₃
2535	OCH ₃	F	Br	OCH ₃	Cl
2536	OCH ₃	F	Br	OCH ₃	F
2537	OCH ₃	F	Br	Cl	H
2538	OCH ₃	F	Br	Cl	CH ₃
2539	OCH ₃	F	Br	Cl	OCH ₃
2540	OCH ₃	F	Br	Cl	Cl
2541	OCH ₃	F	Br	Cl	F
2542	OCH ₃	F	Br	Br	H
2543	OCH ₃	F	Br	Br	CH ₃
2544	OCH ₃	F	Br	Br	OCH ₃
2545	OCH ₃	F	Br	Br	Cl
2546	OCH ₃	F	Br	Br	Br
2547	OCH ₃	F	Br	Br	F
2548	OCH ₃	F	Br	F	H
2549	OCH ₃	F	Br	F	CH ₃
2550	OCH ₃	F	Br	F	OCH ₃
2551	OCH ₃	F	Br	F	Cl
2552	OCH ₃	F	Br	F	F
2553	OCH ₃	F	F	H	H
2554	OCH ₃	F	F	H	CH ₃
2555	OCH ₃	F	F	H	OCH ₃
2556	OCH ₃	F	F	H	Cl
2557	OCH ₃	F	F	H	Br
2558	OCH ₃	F	F	H	F
2559	OCH ₃	F	F	CH ₃	H
2560	OCH ₃	F	F	CH ₃	CH ₃
2561	OCH ₃	F	F	CH ₃	OCH ₃
2562	OCH ₃	F	F	CH ₃	Cl
2563	OCH ₃	F	F	CH ₃	Br
2564	OCH ₃	F	F	OCH ₃	H
2565	OCH ₃	F	F	OCH ₃	CH ₃
2566	OCH ₃	F	F	OCH ₃	OCH ₃
2567	OCH ₃	F	F	OCH ₃	Cl

10

20

30

40

【表2-61】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2568	OCH ₃	F	F	OCH ₃	Br
2569	OCH ₃	F	F	Cl	H
2570	OCH ₃	F	F	Cl	CH ₃
2571	OCH ₃	F	F	Cl	OCH ₃
2572	OCH ₃	F	F	Cl	Cl
2573	OCH ₃	F	F	Cl	Br
2574	OCH ₃	F	F	Br	H
2575	OCH ₃	F	F	Br	CH ₃
2576	OCH ₃	F	F	Br	OCH ₃
2577	OCH ₃	F	F	Br	Cl
2578	OCH ₃	F	F	Br	Br
2579	OCH ₃	F	F	F	H
2580	OCH ₃	F	F	F	CH ₃
2581	OCH ₃	F	F	F	OCH ₃
2582	OCH ₃	F	F	F	Cl
2583	OCH ₃	F	F	F	Br
2584	OCH ₃	F	F	F	F
2585	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H
2586	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
2587	Cl	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
2588	Cl	CH ₃	CH ₃	Cl	H
2589	Cl	CH ₃	CH ₃	Br	H
2590	Cl	CH ₃	CH ₃	F	H
2591	Cl	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
2592	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
2593	Cl	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃
2594	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
2595	Cl	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
2596	Cl	CH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃
2597	Cl	CH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃
2598	Cl	CH ₃	CH ₃	F	OCH ₃
2599	Cl	CH ₃	CH ₃	H	Cl
2600	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
2601	Cl	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl
2602	Cl	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl
2603	Cl	CH ₃	CH ₃	Br	Cl
2604	Cl	CH ₃	CH ₃	F	Cl
2605	Cl	CH ₃	CH ₃	H	Br
2606	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
2607	Cl	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br

10

20

30

40

【表2-62】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2608	Cl	CH ₃	CH ₃	Cl	Br
2609	Cl	CH ₃	CH ₃	Br	Br
2610	Cl	CH ₃	CH ₃	F	Br
2611	Cl	CH ₃	CH ₃	H	F
2612	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F
2613	Cl	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	F
2614	Cl	CH ₃	CH ₃	Cl	F
2615	Cl	CH ₃	CH ₃	Br	F
2616	Cl	CH ₃	CH ₃	F	F
2617	Cl	CH ₃	OCH ₃	H	H
2618	Cl	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
2619	Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H
2620	Cl	CH ₃	OCH ₃	Cl	H
2621	Cl	CH ₃	OCH ₃	Br	H
2622	Cl	CH ₃	OCH ₃	F	H
2623	Cl	CH ₃	OCH ₃	H	CH ₃
2624	Cl	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
2625	Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
2626	Cl	CH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃
2627	Cl	CH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃
2628	Cl	CH ₃	OCH ₃	F	CH ₃
2629	Cl	CH ₃	OCH ₃	H	OCH ₃
2630	Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
2631	Cl	CH ₃	OCH ₃	H	Cl
2632	Cl	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl
2633	Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl
2634	Cl	CH ₃	OCH ₃	Cl	Cl
2635	Cl	CH ₃	OCH ₃	Br	Cl
2636	Cl	CH ₃	OCH ₃	F	Cl
2637	Cl	CH ₃	OCH ₃	H	Br
2638	Cl	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br
2639	Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br
2640	Cl	CH ₃	OCH ₃	Cl	Br
2641	Cl	CH ₃	OCH ₃	Br	Br
2642	Cl	CH ₃	OCH ₃	F	Br
2643	Cl	CH ₃	OCH ₃	H	F
2644	Cl	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	F
2645	Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F
2646	Cl	CH ₃	OCH ₃	Cl	F
2647	Cl	CH ₃	OCH ₃	Br	F

10

20

30

40

【表2-63】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2648	Cl	CH ₃	OCH ₃	F	F
2649	Cl	CH ₃	Cl	H	H
2650	Cl	CH ₃	Cl	CH ₃	H
2651	Cl	CH ₃	Cl	OCH ₃	H
2652	Cl	CH ₃	Cl	Cl	H
2653	Cl	CH ₃	Cl	Br	H
2654	Cl	CH ₃	Cl	F	H
2655	Cl	CH ₃	Cl	H	CH ₃
2656	Cl	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
2657	Cl	CH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃
2658	Cl	CH ₃	Cl	Cl	CH ₃
2659	Cl	CH ₃	Cl	Br	CH ₃
2660	Cl	CH ₃	Cl	F	CH ₃
2661	Cl	CH ₃	Cl	H	OCH ₃
2662	Cl	CH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃
2663	Cl	CH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃
2664	Cl	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃
2665	Cl	CH ₃	Cl	Br	OCH ₃
2666	Cl	CH ₃	Cl	F	OCH ₃
2667	Cl	CH ₃	Cl	H	Cl
2668	Cl	CH ₃	Cl	Cl	Cl
2669	Cl	CH ₃	Cl	H	Br
2670	Cl	CH ₃	Cl	CH ₃	Br
2671	Cl	CH ₃	Cl	OCH ₃	Br
2672	Cl	CH ₃	Cl	Cl	Br
2673	Cl	CH ₃	Cl	Br	Br
2674	Cl	CH ₃	Cl	F	Br
2675	Cl	CH ₃	Cl	H	F
2676	Cl	CH ₃	Cl	CH ₃	F
2677	Cl	CH ₃	Cl	OCH ₃	F
2678	Cl	CH ₃	Cl	Cl	F
2679	Cl	CH ₃	Cl	F	F
2680	Cl	CH ₃	Br	H	H
2681	Cl	CH ₃	Br	CH ₃	H
2682	Cl	CH ₃	Br	OCH ₃	H
2683	Cl	CH ₃	Br	Cl	H
2684	Cl	CH ₃	Br	Br	H
2685	Cl	CH ₃	Br	F	H
2686	Cl	CH ₃	Br	H	CH ₃
2687	Cl	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃

10

20

30

40

【表2-64】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2688	Cl	CH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃
2689	Cl	CH ₃	Br	Cl	CH ₃
2690	Cl	CH ₃	Br	Br	CH ₃
2691	Cl	CH ₃	Br	F	CH ₃
2692	Cl	CH ₃	Br	H	OCH ₃
2693	Cl	CH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃
2694	Cl	CH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃
2695	Cl	CH ₃	Br	Cl	OCH ₃
2696	Cl	CH ₃	Br	Br	OCH ₃
2697	Cl	CH ₃	Br	F	OCH ₃
2698	Cl	CH ₃	Br	H	Cl
2699	Cl	CH ₃	Br	CH ₃	Cl
2700	Cl	CH ₃	Br	OCH ₃	Cl
2701	Cl	CH ₃	Br	Cl	Cl
2702	Cl	CH ₃	Br	Br	Cl
2703	Cl	CH ₃	Br	F	Cl
2704	Cl	CH ₃	Br	H	Br
2705	Cl	CH ₃	Br	Br	Br
2706	Cl	CH ₃	Br	H	F
2707	Cl	CH ₃	Br	CH ₃	F
2708	Cl	CH ₃	Br	OCH ₃	F
2709	Cl	CH ₃	Br	Cl	F
2710	Cl	CH ₃	Br	Br	F
2711	Cl	CH ₃	Br	F	F
2712	Cl	CH ₃	F	H	H
2713	Cl	CH ₃	F	CH ₃	H
2714	Cl	CH ₃	F	OCH ₃	H
2715	Cl	CH ₃	F	Cl	H
2716	Cl	CH ₃	F	Br	H
2717	Cl	CH ₃	F	F	H
2718	Cl	CH ₃	F	H	CH ₃
2719	Cl	CH ₃	F	CH ₃	CH ₃
2720	Cl	CH ₃	F	OCH ₃	CH ₃
2721	Cl	CH ₃	F	Cl	CH ₃
2722	Cl	CH ₃	F	Br	CH ₃
2723	Cl	CH ₃	F	F	CH ₃
2724	Cl	CH ₃	F	H	OCH ₃
2725	Cl	CH ₃	F	CH ₃	OCH ₃
2726	Cl	CH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃
2727	Cl	CH ₃	F	Cl	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-65】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2728	Cl	CH ₃	F	Br	OCH ₃
2729	Cl	CH ₃	F	F	OCH ₃
2730	Cl	CH ₃	F	H	Cl
2731	Cl	CH ₃	F	CH ₃	Cl
2732	Cl	CH ₃	F	OCH ₃	Cl
2733	Cl	CH ₃	F	Cl	Cl
2734	Cl	CH ₃	F	Br	Cl
2735	Cl	CH ₃	F	F	Cl
2736	Cl	CH ₃	F	H	Br
2737	Cl	CH ₃	F	CH ₃	Br
2738	Cl	CH ₃	F	OCH ₃	Br
2739	Cl	CH ₃	F	Cl	Br
2740	Cl	CH ₃	F	Br	Br
2741	Cl	CH ₃	F	F	Br
2742	Cl	CH ₃	F	H	F
2743	Cl	CH ₃	F	F	F
2744	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	H
2745	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	CH ₃
2746	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	OCH ₃
2747	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	Cl
2748	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	Br
2749	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	F
2750	Cl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H
2751	Cl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
2752	Cl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
2753	Cl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
2754	Cl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
2755	Cl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	F
2756	Cl	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
2757	Cl	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
2758	Cl	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl
2759	Cl	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br
2760	Cl	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	F
2761	Cl	OCH ₃	CH ₃	Cl	H
2762	Cl	OCH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃
2763	Cl	OCH ₃	CH ₃	Cl	Cl
2764	Cl	OCH ₃	CH ₃	Cl	Br
2765	Cl	OCH ₃	CH ₃	Cl	F
2766	Cl	OCH ₃	CH ₃	Br	H
2767	Cl	OCH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-66】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2768	Cl	OCH ₃	CH ₃	Br	Cl
2769	Cl	OCH ₃	CH ₃	Br	Br
2770	Cl	OCH ₃	CH ₃	Br	F
2771	Cl	OCH ₃	CH ₃	F	H
2772	Cl	OCH ₃	CH ₃	F	OCH ₃
2773	Cl	OCH ₃	CH ₃	F	Cl
2774	Cl	OCH ₃	CH ₃	F	Br
2775	Cl	OCH ₃	CH ₃	F	F
2776	Cl	OCH ₃	OCH ₃	H	H
2777	Cl	OCH ₃	OCH ₃	H	CH ₃
2778	Cl	OCH ₃	OCH ₃	H	OCH ₃
2779	Cl	OCH ₃	OCH ₃	H	Cl
2780	Cl	OCH ₃	OCH ₃	H	Br
2781	Cl	OCH ₃	OCH ₃	H	F
2782	Cl	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
2783	Cl	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
2784	Cl	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl
2785	Cl	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br
2786	Cl	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	F
2787	Cl	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H
2788	Cl	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
2789	Cl	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
2790	Cl	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl
2791	Cl	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br
2792	Cl	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F
2793	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Cl	H
2794	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃
2795	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Cl
2796	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Br
2797	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Cl	F
2798	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Br	H
2799	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃
2800	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Br	Cl
2801	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Br	Br
2802	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Br	F
2803	Cl	OCH ₃	OCH ₃	F	H
2804	Cl	OCH ₃	OCH ₃	F	CH ₃
2805	Cl	OCH ₃	OCH ₃	F	Cl
2806	Cl	OCH ₃	OCH ₃	F	Br
2807	Cl	OCH ₃	OCH ₃	F	F

10

20

30

40

【表2-67】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2808	Cl	OCH ₃	Cl	H	H
2809	Cl	OCH ₃	Cl	H	CH ₃
2810	Cl	OCH ₃	Cl	H	OCH ₃
2811	Cl	OCH ₃	Cl	H	Cl
2812	Cl	OCH ₃	Cl	H	Br
2813	Cl	OCH ₃	Cl	H	F
2814	Cl	OCH ₃	Cl	CH ₃	H
2815	Cl	OCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
2816	Cl	OCH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃
2817	Cl	OCH ₃	Cl	CH ₃	Br
2818	Cl	OCH ₃	Cl	CH ₃	F
2819	Cl	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H
2820	Cl	OCH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃
2821	Cl	OCH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃
2822	Cl	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Br
2823	Cl	OCH ₃	Cl	OCH ₃	F
2824	Cl	OCH ₃	Cl	Cl	H
2825	Cl	OCH ₃	Cl	Cl	CH ₃
2826	Cl	OCH ₃	Cl	Cl	OCH ₃
2827	Cl	OCH ₃	Cl	Cl	Cl
2828	Cl	OCH ₃	Cl	Cl	Br
2829	Cl	OCH ₃	Cl	Cl	F
2830	Cl	OCH ₃	Cl	Br	H
2831	Cl	OCH ₃	Cl	Br	CH ₃
2832	Cl	OCH ₃	Cl	Br	OCH ₃
2833	Cl	OCH ₃	Cl	Br	Br
2834	Cl	OCH ₃	Cl	F	H
2835	Cl	OCH ₃	Cl	F	CH ₃
2836	Cl	OCH ₃	Cl	F	OCH ₃
2837	Cl	OCH ₃	Cl	F	Br
2838	Cl	OCH ₃	Cl	F	F
2839	Cl	OCH ₃	Br	H	H
2840	Cl	OCH ₃	Br	H	CH ₃
2841	Cl	OCH ₃	Br	H	OCH ₃
2842	Cl	OCH ₃	Br	H	Cl
2843	Cl	OCH ₃	Br	H	Br
2844	Cl	OCH ₃	Br	H	F
2845	Cl	OCH ₃	Br	CH ₃	H
2846	Cl	OCH ₃	Br	CH ₃	CH ₃
2847	Cl	OCH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-68】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2848	Cl	OCH ₃	Br	CH ₃	Cl
2849	Cl	OCH ₃	Br	CH ₃	F
2850	Cl	OCH ₃	Br	OCH ₃	H
2851	Cl	OCH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃
2852	Cl	OCH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃
2853	Cl	OCH ₃	Br	OCH ₃	Cl
2854	Cl	OCH ₃	Br	OCH ₃	F
2855	Cl	OCH ₃	Br	Cl	H
2856	Cl	OCH ₃	Br	Cl	CH ₃
2857	Cl	OCH ₃	Br	Cl	OCH ₃
2858	Cl	OCH ₃	Br	Cl	Cl
2859	Cl	OCH ₃	Br	Cl	F
2860	Cl	OCH ₃	Br	Br	H
2861	Cl	OCH ₃	Br	Br	CH ₃
2862	Cl	OCH ₃	Br	Br	OCH ₃
2863	Cl	OCH ₃	Br	Br	Cl
2864	Cl	OCH ₃	Br	Br	Br
2865	Cl	OCH ₃	Br	Br	F
2866	Cl	OCH ₃	Br	F	H
2867	Cl	OCH ₃	Br	F	CH ₃
2868	Cl	OCH ₃	Br	F	OCH ₃
2869	Cl	OCH ₃	Br	F	Cl
2870	Cl	OCH ₃	Br	F	F
2871	Cl	OCH ₃	F	H	H
2872	Cl	OCH ₃	F	H	CH ₃
2873	Cl	OCH ₃	F	H	OCH ₃
2874	Cl	OCH ₃	F	H	Cl
2875	Cl	OCH ₃	F	H	Br
2876	Cl	OCH ₃	F	H	F
2877	Cl	OCH ₃	F	CH ₃	H
2878	Cl	OCH ₃	F	CH ₃	CH ₃
2879	Cl	OCH ₃	F	CH ₃	OCH ₃
2880	Cl	OCH ₃	F	CH ₃	Cl
2881	Cl	OCH ₃	F	CH ₃	Br
2882	Cl	OCH ₃	F	OCH ₃	H
2883	Cl	OCH ₃	F	OCH ₃	CH ₃
2884	Cl	OCH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃
2885	Cl	OCH ₃	F	OCH ₃	Cl
2886	Cl	OCH ₃	F	OCH ₃	Br
2887	Cl	OCH ₃	F	Cl	H

10

20

30

40

【表2-69】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2888	Cl	OCH ₃	F	Cl	CH ₃
2889	Cl	OCH ₃	F	Cl	OCH ₃
2890	Cl	OCH ₃	F	Cl	Cl
2891	Cl	OCH ₃	F	Cl	Br
2892	Cl	OCH ₃	F	Br	H
2893	Cl	OCH ₃	F	Br	CH ₃
2894	Cl	OCH ₃	F	Br	OCH ₃
2895	Cl	OCH ₃	F	Br	Cl
2896	Cl	OCH ₃	F	Br	Br
2897	Cl	OCH ₃	F	F	H
2898	Cl	OCH ₃	F	F	CH ₃
2899	Cl	OCH ₃	F	F	OCH ₃
2900	Cl	OCH ₃	F	F	Cl
2901	Cl	OCH ₃	F	F	Br
2902	Cl	OCH ₃	F	F	F
2903	Cl	Cl	CH ₃	H	H
2904	Cl	Cl	CH ₃	H	CH ₃
2905	Cl	Cl	CH ₃	H	OCH ₃
2906	Cl	Cl	CH ₃	H	Cl
2907	Cl	Cl	CH ₃	H	Br
2908	Cl	Cl	CH ₃	H	F
2909	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	H
2910	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
2911	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
2912	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	Cl
2913	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	Br
2914	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	F
2915	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	H
2916	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
2917	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	Cl
2918	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	Br
2919	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	F
2920	Cl	Cl	CH ₃	Cl	H
2921	Cl	Cl	CH ₃	Cl	OCH ₃
2922	Cl	Cl	CH ₃	Cl	Cl
2923	Cl	Cl	CH ₃	Cl	Br
2924	Cl	Cl	CH ₃	Cl	F
2925	Cl	Cl	CH ₃	Br	H
2926	Cl	Cl	CH ₃	Br	OCH ₃
2927	Cl	Cl	CH ₃	Br	Cl

10

20

30

40

【表2-70】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2928	Cl	Cl	CH ₃	Br	Br
2929	Cl	Cl	CH ₃	Br	F
2930	Cl	Cl	CH ₃	F	H
2931	Cl	Cl	CH ₃	F	OCH ₃
2932	Cl	Cl	CH ₃	F	Cl
2933	Cl	Cl	CH ₃	F	Br
2934	Cl	Cl	CH ₃	F	F
2935	Cl	Cl	OCH ₃	H	H
2936	Cl	Cl	OCH ₃	H	CH ₃
2937	Cl	Cl	OCH ₃	H	OCH ₃
2938	Cl	Cl	OCH ₃	H	Cl
2939	Cl	Cl	OCH ₃	H	Br
2940	Cl	Cl	OCH ₃	H	F
2941	Cl	Cl	OCH ₃	CH ₃	H
2942	Cl	Cl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
2943	Cl	Cl	OCH ₃	CH ₃	Cl
2944	Cl	Cl	OCH ₃	CH ₃	Br
2945	Cl	Cl	OCH ₃	CH ₃	F
2946	Cl	Cl	OCH ₃	OCH ₃	H
2947	Cl	Cl	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
2948	Cl	Cl	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
2949	Cl	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Cl
2950	Cl	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Br
2951	Cl	Cl	OCH ₃	OCH ₃	F
2952	Cl	Cl	OCH ₃	Cl	H
2953	Cl	Cl	OCH ₃	Cl	CH ₃
2954	Cl	Cl	OCH ₃	Cl	Cl
2955	Cl	Cl	OCH ₃	Cl	Br
2956	Cl	Cl	OCH ₃	Cl	F
2957	Cl	Cl	OCH ₃	Br	H
2958	Cl	Cl	OCH ₃	Br	CH ₃
2959	Cl	Cl	OCH ₃	Br	Cl
2960	Cl	Cl	OCH ₃	Br	Br
2961	Cl	Cl	OCH ₃	Br	F
2962	Cl	Cl	OCH ₃	F	H
2963	Cl	Cl	OCH ₃	F	CH ₃
2964	Cl	Cl	OCH ₃	F	Cl
2965	Cl	Cl	OCH ₃	F	Br
2966	Cl	Cl	OCH ₃	F	F
2967	Cl	Cl	Cl	H	H

10

20

30

40

【表2-71】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
2968	Cl	Cl	Cl	H	CH ₃
2969	Cl	Cl	Cl	H	OCH ₃
2970	Cl	Cl	Cl	H	Cl
2971	Cl	Cl	Cl	H	Br
2972	Cl	Cl	Cl	H	F
2973	Cl	Cl	Cl	CH ₃	H
2974	Cl	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃
2975	Cl	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃
2976	Cl	Cl	Cl	CH ₃	Br
2977	Cl	Cl	Cl	CH ₃	F
2978	Cl	Cl	Cl	OCH ₃	H
2979	Cl	Cl	Cl	OCH ₃	CH ₃
2980	Cl	Cl	Cl	OCH ₃	OCH ₃
2981	Cl	Cl	Cl	OCH ₃	Br
2982	Cl	Cl	Cl	OCH ₃	F
2983	Cl	Cl	Cl	Cl	H
2984	Cl	Cl	Cl	Cl	CH ₃
2985	Cl	Cl	Cl	Cl	OCH ₃
2986	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl
2987	Cl	Cl	Cl	Cl	Br
2988	Cl	Cl	Cl	Cl	F
2989	Cl	Cl	Cl	Br	H
2990	Cl	Cl	Cl	Br	CH ₃
2991	Cl	Cl	Cl	Br	OCH ₃
2992	Cl	Cl	Cl	Br	Br
2993	Cl	Cl	Cl	F	H
2994	Cl	Cl	Cl	F	CH ₃
2995	Cl	Cl	Cl	F	OCH ₃
2996	Cl	Cl	Cl	F	Br
2997	Cl	Cl	Cl	F	F
2998	Cl	Cl	Br	H	H
2999	Cl	Cl	Br	H	CH ₃
3000	Cl	Cl	Br	H	OCH ₃
3001	Cl	Cl	Br	H	Cl
3002	Cl	Cl	Br	H	Br
3003	Cl	Cl	Br	H	F
3004	Cl	Cl	Br	CH ₃	H
3005	Cl	Cl	Br	CH ₃	CH ₃
3006	Cl	Cl	Br	CH ₃	OCH ₃
3007	Cl	Cl	Br	CH ₃	Cl

10

20

30

40

【表2-72】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3008	Cl	Cl	Br	CH ₃	F
3009	Cl	Cl	Br	OCH ₃	H
3010	Cl	Cl	Br	OCH ₃	CH ₃
3011	Cl	Cl	Br	OCH ₃	OCH ₃
3012	Cl	Cl	Br	OCH ₃	Cl
3013	Cl	Cl	Br	OCH ₃	F
3014	Cl	Cl	Br	Cl	H
3015	Cl	Cl	Br	Cl	CH ₃
3016	Cl	Cl	Br	Cl	OCH ₃
3017	Cl	Cl	Br	Cl	Cl
3018	Cl	Cl	Br	Cl	F
3019	Cl	Cl	Br	Br	H
3020	Cl	Cl	Br	Br	CH ₃
3021	Cl	Cl	Br	Br	OCH ₃
3022	Cl	Cl	Br	Br	Cl
3023	Cl	Cl	Br	Br	Br
3024	Cl	Cl	Br	Br	F
3025	Cl	Cl	Br	F	H
3026	Cl	Cl	Br	F	CH ₃
3027	Cl	Cl	Br	F	OCH ₃
3028	Cl	Cl	Br	F	Cl
3029	Cl	Cl	Br	F	F
3030	Cl	Cl	F	H	H
3031	Cl	Cl	F	H	CH ₃
3032	Cl	Cl	F	H	OCH ₃
3033	Cl	Cl	F	H	Cl
3034	Cl	Cl	F	H	Br
3035	Cl	Cl	F	H	F
3036	Cl	Cl	F	CH ₃	H
3037	Cl	Cl	F	CH ₃	CH ₃
3038	Cl	Cl	F	CH ₃	OCH ₃
3039	Cl	Cl	F	CH ₃	Cl
3040	Cl	Cl	F	CH ₃	Br
3041	Cl	Cl	F	OCH ₃	H
3042	Cl	Cl	F	OCH ₃	CH ₃
3043	Cl	Cl	F	OCH ₃	OCH ₃
3044	Cl	Cl	F	OCH ₃	Cl
3045	Cl	Cl	F	OCH ₃	Br
3046	Cl	Cl	F	Cl	H
3047	Cl	Cl	F	Cl	CH ₃

10

20

30

40

【表2-73】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3048	Cl	Cl	F	Cl	OCH ₃
3049	Cl	Cl	F	Cl	Cl
3050	Cl	Cl	F	Cl	Br
3051	Cl	Cl	F	Br	H
3052	Cl	Cl	F	Br	CH ₃
3053	Cl	Cl	F	Br	OCH ₃
3054	Cl	Cl	F	Br	Cl
3055	Cl	Cl	F	Br	Br
3056	Cl	Cl	F	F	H
3057	Cl	Cl	F	F	CH ₃
3058	Cl	Cl	F	F	OCH ₃
3059	Cl	Cl	F	F	Cl
3060	Cl	Cl	F	F	Br
3061	Cl	Cl	F	F	F
3062	Cl	Br	CH ₃	H	H
3063	Cl	Br	CH ₃	H	CH ₃
3064	Cl	Br	CH ₃	H	OCH ₃
3065	Cl	Br	CH ₃	H	Cl
3066	Cl	Br	CH ₃	H	Br
3067	Cl	Br	CH ₃	H	F
3068	Cl	Br	CH ₃	CH ₃	H
3069	Cl	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃
3070	Cl	Br	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
3071	Cl	Br	CH ₃	CH ₃	Cl
3072	Cl	Br	CH ₃	CH ₃	Br
3073	Cl	Br	CH ₃	CH ₃	F
3074	Cl	Br	CH ₃	OCH ₃	H
3075	Cl	Br	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
3076	Cl	Br	CH ₃	OCH ₃	Cl
3077	Cl	Br	CH ₃	OCH ₃	Br
3078	Cl	Br	CH ₃	OCH ₃	F
3079	Cl	Br	CH ₃	Cl	H
3080	Cl	Br	CH ₃	Cl	OCH ₃
3081	Cl	Br	CH ₃	Cl	Cl
3082	Cl	Br	CH ₃	Cl	Br
3083	Cl	Br	CH ₃	Cl	F
3084	Cl	Br	CH ₃	Br	H
3085	Cl	Br	CH ₃	Br	OCH ₃
3086	Cl	Br	CH ₃	Br	Cl
3087	Cl	Br	CH ₃	Br	Br

10

20

30

40

【表2-74】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3088	Cl	Br	CH ₃	Br	F
3089	Cl	Br	CH ₃	F	H
3090	Cl	Br	CH ₃	F	OCH ₃
3091	Cl	Br	CH ₃	F	Cl
3092	Cl	Br	CH ₃	F	Br
3093	Cl	Br	CH ₃	F	F
3094	Cl	Br	OCH ₃	H	H
3095	Cl	Br	OCH ₃	H	CH ₃
3096	Cl	Br	OCH ₃	H	OCH ₃
3097	Cl	Br	OCH ₃	H	Cl
3098	Cl	Br	OCH ₃	H	Br
3099	Cl	Br	OCH ₃	H	F
3100	Cl	Br	OCH ₃	CH ₃	H
3101	Cl	Br	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
3102	Cl	Br	OCH ₃	CH ₃	Cl
3103	Cl	Br	OCH ₃	CH ₃	Br
3104	Cl	Br	OCH ₃	CH ₃	F
3105	Cl	Br	OCH ₃	OCH ₃	H
3106	Cl	Br	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
3107	Cl	Br	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
3108	Cl	Br	OCH ₃	OCH ₃	Cl
3109	Cl	Br	OCH ₃	OCH ₃	Br
3110	Cl	Br	OCH ₃	OCH ₃	F
3111	Cl	Br	OCH ₃	Cl	H
3112	Cl	Br	OCH ₃	Cl	CH ₃
3113	Cl	Br	OCH ₃	Cl	Cl
3114	Cl	Br	OCH ₃	Cl	Br
3115	Cl	Br	OCH ₃	Cl	F
3116	Cl	Br	OCH ₃	Br	H
3117	Cl	Br	OCH ₃	Br	CH ₃
3118	Cl	Br	OCH ₃	Br	Cl
3119	Cl	Br	OCH ₃	Br	Br
3120	Cl	Br	OCH ₃	Br	F
3121	Cl	Br	OCH ₃	F	H
3122	Cl	Br	OCH ₃	F	CH ₃
3123	Cl	Br	OCH ₃	F	Cl
3124	Cl	Br	OCH ₃	F	Br
3125	Cl	Br	OCH ₃	F	F
3126	Cl	Br	Cl	H	H
3127	Cl	Br	Cl	H	CH ₃

10

20

30

40

【表2-75】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3128	Cl	Br	Cl	H	OCH ₃
3129	Cl	Br	Cl	H	Cl
3130	Cl	Br	Cl	H	Br
3131	Cl	Br	Cl	H	F
3132	Cl	Br	Cl	CH ₃	H
3133	Cl	Br	Cl	CH ₃	CH ₃
3134	Cl	Br	Cl	CH ₃	OCH ₃
3135	Cl	Br	Cl	CH ₃	Br
3136	Cl	Br	Cl	CH ₃	F
3137	Cl	Br	Cl	OCH ₃	H
3138	Cl	Br	Cl	OCH ₃	CH ₃
3139	Cl	Br	Cl	OCH ₃	OCH ₃
3140	Cl	Br	Cl	OCH ₃	Br
3141	Cl	Br	Cl	OCH ₃	F
3142	Cl	Br	Cl	Cl	H
3143	Cl	Br	Cl	Cl	CH ₃
3144	Cl	Br	Cl	Cl	OCH ₃
3145	Cl	Br	Cl	Cl	Cl
3146	Cl	Br	Cl	Cl	Br
3147	Cl	Br	Cl	Cl	F
3148	Cl	Br	Cl	Br	H
3149	Cl	Br	Cl	Br	CH ₃
3150	Cl	Br	Cl	Br	OCH ₃
3151	Cl	Br	Cl	Br	Br
3152	Cl	Br	Cl	F	H
3153	Cl	Br	Cl	F	CH ₃
3154	Cl	Br	Cl	F	OCH ₃
3155	Cl	Br	Cl	F	Br
3156	Cl	Br	Cl	F	F
3157	Cl	Br	Br	H	H
3158	Cl	Br	Br	H	CH ₃
3159	Cl	Br	Br	H	OCH ₃
3160	Cl	Br	Br	H	Cl
3161	Cl	Br	Br	H	Br
3162	Cl	Br	Br	H	F
3163	Cl	Br	Br	CH ₃	H
3164	Cl	Br	Br	CH ₃	CH ₃
3165	Cl	Br	Br	CH ₃	OCH ₃
3166	Cl	Br	Br	CH ₃	Cl
3167	Cl	Br	Br	CH ₃	F

10

20

30

40

【表2-76】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3168	Cl	Br	Br	OCH ₃	H
3169	Cl	Br	Br	OCH ₃	CH ₃
3170	Cl	Br	Br	OCH ₃	OCH ₃
3171	Cl	Br	Br	OCH ₃	Cl
3172	Cl	Br	Br	OCH ₃	F
3173	Cl	Br	Br	Cl	H
3174	Cl	Br	Br	Cl	CH ₃
3175	Cl	Br	Br	Cl	OCH ₃
3176	Cl	Br	Br	Cl	Cl
3177	Cl	Br	Br	Cl	F
3178	Cl	Br	Br	Br	H
3179	Cl	Br	Br	Br	CH ₃
3180	Cl	Br	Br	Br	OCH ₃
3181	Cl	Br	Br	Br	Cl
3182	Cl	Br	Br	Br	Br
3183	Cl	Br	Br	Br	F
3184	Cl	Br	Br	F	H
3185	Cl	Br	Br	F	CH ₃
3186	Cl	Br	Br	F	OCH ₃
3187	Cl	Br	Br	F	Cl
3188	Cl	Br	Br	F	F
3189	Cl	Br	F	H	H
3190	Cl	Br	F	H	CH ₃
3191	Cl	Br	F	H	OCH ₃
3192	Cl	Br	F	H	Cl
3193	Cl	Br	F	H	Br
3194	Cl	Br	F	H	F
3195	Cl	Br	F	CH ₃	H
3196	Cl	Br	F	CH ₃	CH ₃
3197	Cl	Br	F	CH ₃	OCH ₃
3198	Cl	Br	F	CH ₃	Cl
3199	Cl	Br	F	CH ₃	Br
3200	Cl	Br	F	OCH ₃	H
3201	Cl	Br	F	OCH ₃	CH ₃
3202	Cl	Br	F	OCH ₃	OCH ₃
3203	Cl	Br	F	OCH ₃	Cl
3204	Cl	Br	F	OCH ₃	Br
3205	Cl	Br	F	Cl	H
3206	Cl	Br	F	Cl	CH ₃
3207	Cl	Br	F	Cl	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-77】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3208	Cl	Br	F	Cl	Cl
3209	Cl	Br	F	Cl	Br
3210	Cl	Br	F	Br	H
3211	Cl	Br	F	Br	CH ₃
3212	Cl	Br	F	Br	OCH ₃
3213	Cl	Br	F	Br	Cl
3214	Cl	Br	F	Br	Br
3215	Cl	Br	F	F	H
3216	Cl	Br	F	F	CH ₃
3217	Cl	Br	F	F	OCH ₃
3218	Cl	Br	F	F	Cl
3219	Cl	Br	F	F	Br
3220	Cl	Br	F	F	F
3221	Cl	F	CH ₃	H	H
3222	Cl	F	CH ₃	H	CH ₂
3223	Cl	F	CH ₃	H	OCH ₃
3224	Cl	F	CH ₃	H	Cl
3225	Cl	F	CH ₃	H	Br
3226	Cl	F	CH ₃	H	F
3227	Cl	F	CH ₃	CH ₃	H
3228	Cl	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
3229	Cl	F	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
3230	Cl	F	CH ₃	CH ₃	Cl
3231	Cl	F	CH ₃	CH ₃	Br
3232	Cl	F	CH ₃	CH ₃	F
3233	Cl	F	CH ₃	OCH ₃	H
3234	Cl	F	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
3235	Cl	F	CH ₃	OCH ₃	Cl
3236	Cl	F	CH ₃	OCH ₃	Br
3237	Cl	F	CH ₃	OCH ₃	F
3238	Cl	F	CH ₃	Cl	H
3239	Cl	F	CH ₃	Cl	OCH ₃
3240	Cl	F	CH ₃	Cl	Cl
3241	Cl	F	CH ₃	Cl	Br
3242	Cl	F	CH ₃	Cl	F
3243	Cl	F	CH ₃	Br	H
3244	Cl	F	CH ₃	Br	OCH ₃
3245	Cl	F	CH ₃	Br	Cl
3246	Cl	F	CH ₃	Br	Br
3247	Cl	F	CH ₃	Br	F

10

20

30

40

【表2-78】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3248	Cl	F	CH ₃	F	H
3249	Cl	F	CH ₃	F	OCH ₃
3250	Cl	F	CH ₃	F	Cl
3251	Cl	F	CH ₃	F	Br
3252	Cl	F	CH ₃	F	F
3253	Cl	F	OCH ₃	H	H
3254	Cl	F	OCH ₃	H	CH ₃
3255	Cl	F	OCH ₃	H	OCH ₃
3256	Cl	F	OCH ₃	H	Cl
3257	Cl	F	OCH ₃	H	Br
3258	Cl	F	OCH ₃	H	F
3259	Cl	F	OCH ₃	CH ₃	H
3260	Cl	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
3261	Cl	F	OCH ₃	CH ₃	Cl
3262	Cl	F	OCH ₃	CH ₃	Br
3263	Cl	F	OCH ₃	CH ₃	F
3264	Cl	F	OCH ₃	OCH ₃	H
3265	Cl	F	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
3266	Cl	F	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
3267	Cl	F	OCH ₃	OCH ₃	Cl
3268	Cl	F	OCH ₃	OCH ₃	Br
3269	Cl	F	OCH ₃	OCH ₃	F
3270	Cl	F	OCH ₃	Cl	H
3271	Cl	F	OCH ₃	Cl	CH ₃
3272	Cl	F	OCH ₃	Cl	Cl
3273	Cl	F	OCH ₃	Cl	Br
3274	Cl	F	OCH ₃	Cl	F
3275	Cl	F	OCH ₃	Br	H
3276	Cl	F	OCH ₃	Br	CH ₃
3277	Cl	F	OCH ₃	Br	Cl
3278	Cl	F	OCH ₃	Br	Br
3279	Cl	F	OCH ₃	Br	F
3280	Cl	F	OCH ₃	F	H
3281	Cl	F	OCH ₃	F	CH ₃
3282	Cl	F	OCH ₃	F	Cl
3283	Cl	F	OCH ₃	F	Br
3284	Cl	F	OCH ₃	F	F
3285	Cl	F	Cl	H	H
3286	Cl	F	Cl	H	CH ₃
3287	Cl	F	Cl	H	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-79】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3288	Cl	F	Cl	H	Cl
3289	Cl	F	Cl	H	Br
3290	Cl	F	Cl	H	F
3291	Cl	F	Cl	CH ₃	H
3292	Cl	F	Cl	CH ₃	CH ₃
3293	Cl	F	Cl	CH ₃	OCH ₃
3294	Cl	F	Cl	CH ₃	Br
3295	Cl	F	Cl	CH ₃	F
3296	Cl	F	Cl	OCH ₃	H
3297	Cl	F	Cl	OCH ₃	CH ₃
3298	Cl	F	Cl	OCH ₃	OCH ₃
3299	Cl	F	Cl	OCH ₃	Br
3300	Cl	F	Cl	OCH ₃	F
3301	Cl	F	Cl	Cl	H
3302	Cl	F	Cl	Cl	CH ₃
3303	Cl	F	Cl	Cl	OCH ₃
3304	Cl	F	Cl	Cl	Cl
3305	Cl	F	Cl	Cl	Br
3306	Cl	F	Cl	Cl	F
3307	Cl	F	Cl	Br	H
3308	Cl	F	Cl	Br	CH ₃
3309	Cl	F	Cl	Br	OCH ₃
3310	Cl	F	Cl	Br	Br
3311	Cl	F	Cl	F	H
3312	Cl	F	Cl	F	CH ₃
3313	Cl	F	Cl	F	OCH ₃
3314	Cl	F	Cl	F	Br
3315	Cl	F	Cl	F	F
3316	Cl	F	Br	H	H
3317	Cl	F	Br	H	CH ₃
3318	Cl	F	Br	H	OCH ₃
3319	Cl	F	Br	H	Cl
3320	Cl	F	Br	H	Br
3321	Cl	F	Br	H	F
3322	Cl	F	Br	CH ₃	H
3323	Cl	F	Br	CH ₃	CH ₃
3324	Cl	F	Br	CH ₃	OCH ₃
3325	Cl	F	Br	CH ₃	Cl
3326	Cl	F	Br	CH ₃	F
3327	Cl	F	Br	OCH ₃	H

10

20

30

40

【表2-80】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3328	Cl	F	Br	OCH ₃	CH ₃
3329	Cl	F	Br	OCH ₃	OCH ₃
3330	Cl	F	Br	OCH ₃	Cl
3331	Cl	F	Br	OCH ₃	F
3332	Cl	F	Br	Cl	H
3333	Cl	F	Br	Cl	CH ₃
3334	Cl	F	Br	Cl	OCH ₃
3335	Cl	F	Br	Cl	Cl
3336	Cl	F	Br	Cl	F
3337	Cl	F	Br	Br	H
3338	Cl	F	Br	Br	CH ₃
3339	Cl	F	Br	Br	OCH ₃
3340	Cl	F	Br	Br	Cl
3341	Cl	F	Br	Br	Br
3342	Cl	F	Br	Br	F
3343	Cl	F	Br	F	H
3344	Cl	F	Br	F	CH ₃
3345	Cl	F	Br	F	OCH ₃
3346	Cl	F	Br	F	Cl
3347	Cl	F	Br	F	F
3348	Cl	F	F	H	H
3349	Cl	F	F	H	CH ₃
3350	Cl	F	F	H	OCH ₃
3351	Cl	F	F	H	Cl
3352	Cl	F	F	H	Br
3353	Cl	F	F	H	F
3354	Cl	F	F	CH ₃	H
3355	Cl	F	F	CH ₃	CH ₃
3356	Cl	F	F	CH ₃	OCH ₃
3357	Cl	F	F	CH ₃	Cl
3358	Cl	F	F	CH ₃	Br
3359	Cl	F	F	OCH ₃	H
3360	Cl	F	F	OCH ₃	CH ₃
3361	Cl	F	F	OCH ₃	OCH ₃
3362	Cl	F	F	OCH ₃	Cl
3363	Cl	F	F	OCH ₃	Br
3364	Cl	F	F	Cl	H
3365	Cl	F	F	Cl	CH ₃
3366	Cl	F	F	Cl	OCH ₃
3367	Cl	F	F	Cl	Cl

10

20

30

40

【表2-81】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3368	Cl	F	F	Cl	Br
3369	Cl	F	F	Br	H
3370	Cl	F	F	Br	CH ₃
3371	Cl	F	F	Br	OCH ₃
3372	Cl	F	F	Br	Cl
3373	Cl	F	F	Br	Br
3374	Cl	F	F	F	H
3375	Cl	F	F	F	CH ₃
3376	Cl	F	F	F	OCH ₃
3377	Cl	F	F	F	Cl
3378	Cl	F	F	F	Br
3379	Cl	F	F	F	F
3380	Br	CH ₃	CH ₃	H	H
3381	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
3382	Br	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
3383	Br	CH ₃	CH ₃	Cl	H
3384	Br	CH ₃	CH ₃	Br	H
3385	Br	CH ₃	CH ₃	F	H
3386	Br	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
3387	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
3388	Br	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃
3389	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
3390	Br	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
3391	Br	CH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃
3392	Br	CH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃
3393	Br	CH ₃	CH ₃	F	OCH ₃
3394	Br	CH ₃	CH ₃	H	Cl
3395	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
3396	Br	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl
3397	Br	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl
3398	Br	CH ₃	CH ₃	Br	Cl
3399	Br	CH ₃	CH ₃	F	Cl
3400	Br	CH ₃	CH ₃	H	Br
3401	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
3402	Br	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br
3403	Br	CH ₃	CH ₃	Cl	Br
3404	Br	CH ₃	CH ₃	Br	Br
3405	Br	CH ₃	CH ₃	F	Br
3406	Br	CH ₃	CH ₃	H	F
3407	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F

10

20

30

40

【表2-82】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3408	Br	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	F
3409	Br	CH ₃	CH ₃	Cl	F
3410	Br	CH ₃	CH ₃	Br	F
3411	Br	CH ₃	CH ₃	F	F
3412	Br	CH ₃	OCH ₃	H	H
3413	Br	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
3414	Br	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H
3415	Br	CH ₃	OCH ₃	Cl	H
3416	Br	CH ₃	OCH ₃	Br	H
3417	Br	CH ₃	OCH ₃	F	H
3418	Br	CH ₃	OCH ₃	H	CH ₃
3419	Br	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
3420	Br	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
3421	Br	CH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃
3422	Br	CH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃
3423	Br	CH ₃	OCH ₃	F	CH ₃
3424	Br	CH ₃	OCH ₃	H	OCH ₃
3425	Br	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
3426	Br	CH ₃	OCH ₃	H	Cl
3427	Br	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl
3428	Br	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl
3429	Br	CH ₃	OCH ₃	Cl	Cl
3430	Br	CH ₃	OCH ₃	Br	Cl
3431	Br	CH ₃	OCH ₃	F	Cl
3432	Br	CH ₃	OCH ₃	H	Br
3433	Br	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br
3434	Br	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br
3435	Br	CH ₃	OCH ₃	Cl	Br
3436	Br	CH ₃	OCH ₃	Br	Br
3437	Br	CH ₃	OCH ₃	F	Br
3438	Br	CH ₃	OCH ₃	H	F
3439	Br	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	F
3440	Br	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F
3441	Br	CH ₃	OCH ₃	Cl	F
3442	Br	CH ₃	OCH ₃	Br	F
3443	Br	CH ₃	OCH ₃	F	F
3444	Br	CH ₃	Cl	H	H
3445	Br	CH ₃	Cl	CH ₃	H
3446	Br	CH ₃	Cl	OCH ₃	H
3447	Br	CH ₃	Cl	Cl	H

10

20

30

40

【表2-83】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3448	Br	CH ₃	Cl	Br	H
3449	Br	CH ₃	Cl	F	H
3450	Br	CH ₃	Cl	H	CH ₃
3451	Br	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
3452	Br	CH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃
3453	Br	CH ₃	Cl	Cl	CH ₃
3454	Br	CH ₃	Cl	Br	CH ₃
3455	Br	CH ₃	Cl	F	CH ₃
3456	Br	CH ₃	Cl	H	OCH ₃
3457	Br	CH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃
3458	Br	CH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃
3459	Br	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃
3460	Br	CH ₃	Cl	Br	OCH ₃
3461	Br	CH ₃	Cl	F	OCH ₃
3462	Br	CH ₃	Cl	H	Cl
3463	Br	CH ₃	Cl	Cl	Cl
3464	Br	CH ₃	Cl	H	Br
3465	Br	CH ₃	Cl	CH ₃	Br
3466	Br	CH ₃	Cl	OCH ₃	Br
3467	Br	CH ₃	Cl	Cl	Br
3468	Br	CH ₃	Cl	Br	Br
3469	Br	CH ₃	Cl	F	Br
3470	Br	CH ₃	Cl	H	F
3471	Br	CH ₃	Cl	CH ₃	F
3472	Br	CH ₃	Cl	OCH ₃	F
3473	Br	CH ₃	Cl	Cl	F
3474	Br	CH ₃	Cl	F	F
3475	Br	CH ₃	Br	H	H
3476	Br	CH ₃	Br	CH ₃	H
3477	Br	CH ₃	Br	OCH ₃	H
3478	Br	CH ₃	Br	Cl	H
3479	Br	CH ₃	Br	Br	H
3480	Br	CH ₃	Br	F	H
3481	Br	CH ₃	Br	H	CH ₃
3482	Br	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃
3483	Br	CH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃
3484	Br	CH ₃	Br	Cl	CH ₃
3485	Br	CH ₃	Br	Br	CH ₃
3486	Br	CH ₃	Br	F	CH ₃
3487	Br	CH ₃	Br	H	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-84】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3488	Br	CH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃
3489	Br	CH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃
3490	Br	CH ₃	Br	Cl	OCH ₃
3491	Br	CH ₃	Br	Br	OCH ₃
3492	Br	CH ₃	Br	F	OCH ₃
3493	Br	CH ₃	Br	H	Cl
3494	Br	CH ₃	Br	CH ₃	Cl
3495	Br	CH ₃	Br	OCH ₃	Cl
3496	Br	CH ₃	Br	Cl	Cl
3497	Br	CH ₃	Br	Br	Cl
3498	Br	CH ₃	Br	F	Cl
3499	Br	CH ₃	Br	H	Br
3500	Br	CH ₃	Br	Br	Br
3501	Br	CH ₃	Br	H	F
3502	Br	CH ₃	Br	CH ₃	F
3503	Br	CH ₃	Br	OCH ₃	F
3504	Br	CH ₃	Br	Cl	F
3505	Br	CH ₃	Br	Br	F
3506	Br	CH ₃	Br	F	F
3507	Br	CH ₃	F	H	H
3508	Br	CH ₃	F	CH ₃	H
3509	Br	CH ₃	F	OCH ₃	H
3510	Br	CH ₃	F	Cl	H
3511	Br	CH ₃	F	Br	H
3512	Br	CH ₃	F	F	H
3513	Br	CH ₃	F	H	CH ₃
3514	Br	CH ₃	F	CH ₃	CH ₃
3515	Br	CH ₃	F	OCH ₃	CH ₃
3516	Br	CH ₃	F	Cl	CH ₃
3517	Br	CH ₃	F	Br	CH ₃
3518	Br	CH ₃	F	F	CH ₃
3519	Br	CH ₃	F	H	OCH ₃
3520	Br	CH ₃	F	CH ₃	OCH ₃
3521	Br	CH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃
3522	Br	CH ₃	F	Cl	OCH ₃
3523	Br	CH ₃	F	Br	OCH ₃
3524	Br	CH ₃	F	F	OCH ₃
3525	Br	CH ₃	F	H	Cl
3526	Br	CH ₃	F	CH ₃	Cl
3527	Br	CH ₃	F	OCH ₃	Cl

10

20

30

40

【表2-85】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3528	Br	CH ₃	F	Cl	Cl
3529	Br	CH ₃	F	Br	Cl
3530	Br	CH ₃	F	F	Cl
3531	Br	CH ₃	F	H	Br
3532	Br	CH ₃	F	CH ₃	Br
3533	Br	CH ₃	F	OCH ₃	Br
3534	Br	CH ₃	F	Cl	Br
3535	Br	CH ₃	F	Br	Br
3536	Br	CH ₃	F	F	Br
3537	Br	CH ₃	F	H	F
3538	Br	CH ₃	F	F	F
3539	Br	OCH ₃	CH ₃	H	H
3540	Br	OCH ₃	CH ₃	H	CH ₃
3541	Br	OCH ₃	CH ₃	H	OCH ₃
3542	Br	OCH ₃	CH ₃	H	Cl
3543	Br	OCH ₃	CH ₃	H	Br
3544	Br	OCH ₃	CH ₃	H	F
3545	Br	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H
3546	Br	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
3547	Br	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
3548	Br	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
3549	Br	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
3550	Br	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	F
3551	Br	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
3552	Br	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
3553	Br	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl
3554	Br	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br
3555	Br	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	F
3556	Br	OCH ₃	CH ₃	Cl	H
3557	Br	OCH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃
3558	Br	OCH ₃	CH ₃	Cl	Cl
3559	Br	OCH ₃	CH ₃	Cl	Br
3560	Br	OCH ₃	CH ₃	Cl	F
3561	Br	OCH ₃	CH ₃	Br	H
3562	Br	OCH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃
3563	Br	OCH ₃	CH ₃	Br	Cl
3564	Br	OCH ₃	CH ₃	Br	Br
3565	Br	OCH ₃	CH ₃	Br	F
3566	Br	OCH ₃	CH ₃	F	H
3567	Br	OCH ₃	CH ₃	F	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-86】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3568	Br	OCH ₃	CH ₃	F	Cl
3569	Br	OCH ₃	CH ₃	F	Br
3570	Br	OCH ₃	CH ₃	F	F
3571	Br	OCH ₃	OCH ₃	H	H
3572	Br	OCH ₃	OCH ₃	H	CH ₃
3573	Br	OCH ₃	OCH ₃	H	OCH ₃
3574	Br	OCH ₃	OCH ₃	H	Cl
3575	Br	OCH ₃	OCH ₃	H	Br
3576	Br	OCH ₃	OCH ₃	H	F
3577	Br	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
3578	Br	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
3579	Br	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl
3580	Br	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br
3581	Br	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	F
3582	Br	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H
3583	Br	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
3584	Br	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
3585	Br	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl
3586	Br	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br
3587	Br	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F
3588	Br	OCH ₃	OCH ₃	Cl	H
3589	Br	OCH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃
3590	Br	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Cl
3591	Br	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Br
3592	Br	OCH ₃	OCH ₃	Cl	F
3593	Br	OCH ₃	OCH ₃	Br	H
3594	Br	OCH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃
3595	Br	OCH ₃	OCH ₃	Br	Cl
3596	Br	OCH ₃	OCH ₃	Br	Br
3597	Br	OCH ₃	OCH ₃	Br	F
3598	Br	OCH ₃	OCH ₃	F	H
3599	Br	OCH ₃	OCH ₃	F	CH ₃
3600	Br	OCH ₃	OCH ₃	F	Cl
3601	Br	OCH ₃	OCH ₃	F	Br
3602	Br	OCH ₃	OCH ₃	F	F
3603	Br	OCH ₃	Cl	H	H
3604	Br	OCH ₃	Cl	H	CH ₃
3605	Br	OCH ₃	Cl	H	OCH ₃
3606	Br	OCH ₃	Cl	H	Cl
3607	Br	OCH ₃	Cl	H	Br

10

20

30

40

【表2-87】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3608	Br	OCH ₃	Cl	H	F
3609	Br	OCH ₃	Cl	CH ₃	H
3610	Br	OCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
3611	Br	OCH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃
3612	Br	OCH ₃	Cl	CH ₃	Br
3613	Br	OCH ₃	Cl	CH ₃	F
3614	Br	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H
3615	Br	OCH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃
3616	Br	OCH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃
3617	Br	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Br
3618	Br	OCH ₃	Cl	OCH ₃	F
3619	Br	OCH ₃	Cl	Cl	H
3620	Br	OCH ₃	Cl	Cl	CH ₃
3621	Br	OCH ₃	Cl	Cl	OCH ₃
3622	Br	OCH ₃	Cl	Cl	Cl
3623	Br	OCH ₃	Cl	Cl	Br
3624	Br	OCH ₃	Cl	Cl	F
3625	Br	OCH ₃	Cl	Br	H
3626	Br	OCH ₃	Cl	Br	CH ₃
3627	Br	OCH ₃	Cl	Br	OCH ₃
3628	Br	OCH ₃	Cl	Br	Br
3629	Br	OCH ₃	Cl	F	H
3630	Br	OCH ₃	Cl	F	CH ₃
3631	Br	OCH ₃	Cl	F	OCH ₃
3632	Br	OCH ₃	Cl	F	Br
3633	Br	OCH ₃	Cl	F	F
3634	Br	OCH ₃	Br	H	H
3635	Br	OCH ₃	Br	H	CH ₃
3636	Br	OCH ₃	Br	H	OCH ₃
3637	Br	OCH ₃	Br	H	Cl
3638	Br	OCH ₃	Br	H	Br
3639	Br	OCH ₃	Br	H	F
3640	Br	OCH ₃	Br	CH ₃	H
3641	Br	OCH ₃	Br	CH ₃	CH ₃
3642	Br	OCH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃
3643	Br	OCH ₃	Br	CH ₃	Cl
3644	Br	OCH ₃	Br	CH ₃	F
3645	Br	OCH ₃	Br	OCH ₃	H
3646	Br	OCH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃
3647	Br	OCH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-88】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3648	Br	OCH ₃	Br	OCH ₃	Cl
3649	Br	OCH ₃	Br	OCH ₃	F
3650	Br	OCH ₃	Br	Cl	H
3651	Br	OCH ₃	Br	Cl	CH ₃
3652	Br	OCH ₃	Br	Cl	OCH ₃
3653	Br	OCH ₃	Br	Cl	Cl
3654	Br	OCH ₃	Br	Cl	F
3655	Br	OCH ₃	Br	Br	H
3656	Br	OCH ₃	Br	Br	CH ₃
3657	Br	OCH ₃	Br	Br	OCH ₃
3658	Br	OCH ₃	Br	Br	Cl
3659	Br	OCH ₃	Br	Br	Br
3660	Br	OCH ₃	Br	Br	F
3661	Br	OCH ₃	Br	F	H
3662	Br	OCH ₃	Br	F	CH ₃
3663	Br	OCH ₃	Br	F	OCH ₃
3664	Br	OCH ₃	Br	F	Cl
3665	Br	OCH ₃	Br	F	F
3666	Br	OCH ₃	F	H	H
3667	Br	OCH ₃	F	H	CH ₃
3668	Br	OCH ₃	F	H	OCH ₃
3669	Br	OCH ₃	F	H	Cl
3670	Br	OCH ₃	F	H	Br
3671	Br	OCH ₃	F	H	F
3672	Br	OCH ₃	F	CH ₃	H
3673	Br	OCH ₃	F	CH ₃	CH ₃
3674	Br	OCH ₃	F	CH ₃	OCH ₃
3675	Br	OCH ₃	F	CH ₃	Cl
3676	Br	OCH ₃	F	CH ₃	Br
3677	Br	OCH ₃	F	OCH ₃	H
3678	Br	OCH ₃	F	OCH ₃	CH ₃
3679	Br	OCH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃
3680	Br	OCH ₃	F	OCH ₃	Cl
3681	Br	OCH ₃	F	OCH ₃	Br
3682	Br	OCH ₃	F	Cl	H
3683	Br	OCH ₃	F	Cl	CH ₃
3684	Br	OCH ₃	F	Cl	OCH ₃
3685	Br	OCH ₃	F	Cl	Cl
3686	Br	OCH ₃	F	Cl	Br
3687	Br	OCH ₃	F	Br	H

10

20

30

40

【表2-89】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3688	Br	OCH ₃	F	Br	CH ₃
3689	Br	OCH ₃	F	Br	OCH ₃
3690	Br	OCH ₃	F	Br	Cl
3691	Br	OCH ₃	F	Br	Br
3692	Br	OCH ₃	F	F	H
3693	Br	OCH ₃	F	F	CH ₃
3694	Br	OCH ₃	F	F	OCH ₃
3695	Br	OCH ₃	F	F	Cl
3696	Br	OCH ₃	F	F	Br
3697	Br	OCH ₃	F	F	F
3698	Br	Cl	CH ₃	H	H
3699	Br	Cl	CH ₃	H	CH ₃
3700	Br	Cl	CH ₃	H	OCH ₃
3701	Br	Cl	CH ₃	H	Cl
3702	Br	Cl	CH ₃	H	Br
3703	Br	Cl	CH ₃	H	F
3704	Br	Cl	CH ₃	CH ₃	H
3705	Br	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
3706	Br	Cl	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
3707	Br	Cl	CH ₃	CH ₃	Cl
3708	Br	Cl	CH ₃	CH ₃	Br
3709	Br	Cl	CH ₃	CH ₃	F
3710	Br	Cl	CH ₃	OCH ₃	H
3711	Br	Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
3712	Br	Cl	CH ₃	OCH ₃	Cl
3713	Br	Cl	CH ₃	OCH ₃	Br
3714	Br	Cl	CH ₃	OCH ₃	F
3715	Br	Cl	CH ₃	Cl	H
3716	Br	Cl	CH ₃	Cl	OCH ₃
3717	Br	Cl	CH ₃	Cl	Cl
3718	Br	Cl	CH ₃	Cl	Br
3719	Br	Cl	CH ₃	Cl	F
3720	Br	Cl	CH ₃	Br	H
3721	Br	Cl	CH ₃	Br	OCH ₃
3722	Br	Cl	CH ₃	Br	Cl
3723	Br	Cl	CH ₃	Br	Br
3724	Br	Cl	CH ₃	Br	F
3725	Br	Cl	CH ₃	F	H
3726	Br	Cl	CH ₃	F	OCH ₃
3727	Br	Cl	CH ₃	F	Cl

10

20

30

40

【表2-90】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3728	Br	Cl	CH ₃	F	Br
3729	Br	Cl	CH ₃	F	F
3730	Br	Cl	OCH ₃	H	H
3731	Br	Cl	OCH ₃	H	CH ₃
3732	Br	Cl	OCH ₃	H	OCH ₃
3733	Br	Cl	OCH ₃	H	Cl
3734	Br	Cl	OCH ₃	H	Br
3735	Br	Cl	OCH ₃	H	F
3736	Br	Cl	OCH ₃	CH ₃	H
3737	Br	Cl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
3738	Br	Cl	OCH ₃	CH ₃	Cl
3739	Br	Cl	OCH ₃	CH ₃	Br
3740	Br	Cl	OCH ₃	CH ₃	F
3741	Br	Cl	OCH ₃	OCH ₃	H
3742	Br	Cl	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
3743	Br	Cl	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
3744	Br	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Cl
3745	Br	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Br
3746	Br	Cl	OCH ₃	OCH ₃	F
3747	Br	Cl	OCH ₃	Cl	H
3748	Br	Cl	OCH ₃	Cl	CH ₃
3749	Br	Cl	OCH ₃	Cl	Cl
3750	Br	Cl	OCH ₃	Cl	Br
3751	Br	Cl	OCH ₃	Cl	F
3752	Br	Cl	OCH ₃	Br	H
3753	Br	Cl	OCH ₃	Br	CH ₃
3754	Br	Cl	OCH ₃	Br	Cl
3755	Br	Cl	OCH ₃	Br	Br
3756	Br	Cl	OCH ₃	Br	F
3757	Br	Cl	OCH ₃	F	H
3758	Br	Cl	OCH ₃	F	CH ₃
3759	Br	Cl	OCH ₃	F	Cl
3760	Br	Cl	OCH ₃	F	Br
3761	Br	Cl	OCH ₃	F	F
3762	Br	Cl	Cl	H	H
3763	Br	Cl	Cl	H	CH ₃
3764	Br	Cl	Cl	H	OCH ₃
3765	Br	Cl	Cl	H	Cl
3766	Br	Cl	Cl	H	Br
3767	Br	Cl	Cl	H	F

10

20

30

40

【表2-91】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3768	Br	Cl	Cl	CH ₃	H
3769	Br	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃
3770	Br	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃
3771	Br	Cl	Cl	CH ₃	Br
3772	Br	Cl	Cl	CH ₃	F
3773	Br	Cl	Cl	OCH ₃	H
3774	Br	Cl	Cl	OCH ₃	CH ₃
3775	Br	Cl	Cl	OCH ₃	OCH ₃
3776	Br	Cl	Cl	OCH ₃	Br
3777	Br	Cl	Cl	OCH ₃	F
3778	Br	Cl	Cl	Cl	H
3779	Br	Cl	Cl	Cl	CH ₃
3780	Br	Cl	Cl	Cl	OCH ₃
3781	Br	Cl	Cl	Cl	Cl
3782	Br	Cl	Cl	Cl	Br
3783	Br	Cl	Cl	Cl	F
3784	Br	Cl	Cl	Br	H
3785	Br	Cl	Cl	Br	CH ₃
3786	Br	Cl	Cl	Br	OCH ₃
3787	Br	Cl	Cl	Br	Br
3788	Br	Cl	Cl	F	H
3789	Br	Cl	Cl	F	CH ₃
3790	Br	Cl	Cl	F	OCH ₃
3791	Br	Cl	Cl	F	Br
3792	Br	Cl	Cl	F	F
3793	Br	Cl	Br	H	H
3794	Br	Cl	Br	H	CH ₃
3795	Br	Cl	Br	H	OCH ₃
3796	Br	Cl	Br	H	Cl
3797	Br	Cl	Br	H	Br
3798	Br	Cl	Br	H	F
3799	Br	Cl	Br	CH ₃	H
3800	Br	Cl	Br	CH ₃	CH ₃
3801	Br	Cl	Br	CH ₃	OCH ₃
3802	Br	Cl	Br	CH ₃	Cl
3803	Br	Cl	Br	CH ₃	F
3804	Br	Cl	Br	OCH ₃	H
3805	Br	Cl	Br	OCH ₃	CH ₃
3806	Br	Cl	Br	OCH ₃	OCH ₃
3807	Br	Cl	Br	OCH ₃	Cl

10

20

30

40

【表2-92】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3808	Br	Cl	Br	OCH ₃	F
3809	Br	Cl	Br	Cl	H
3810	Br	Cl	Br	Cl	CH ₃
3811	Br	Cl	Br	Cl	OCH ₃
3812	Br	Cl	Br	Cl	Cl
3813	Br	Cl	Br	Cl	F
3814	Br	Cl	Br	Br	H
3815	Br	Cl	Br	Br	CH ₃
3816	Br	Cl	Br	Br	OCH ₃
3817	Br	Cl	Br	Br	Cl
3818	Br	Cl	Br	Br	Br
3819	Br	Cl	Br	Br	F
3820	Br	Cl	Br	F	H
3821	Br	Cl	Br	F	CH ₃
3822	Br	Cl	Br	F	OCH ₃
3823	Br	Cl	Br	F	Cl
3824	Br	Cl	Br	F	F
3825	Br	Cl	F	H	H
3826	Br	Cl	F	H	CH ₃
3827	Br	Cl	F	H	OCH ₃
3828	Br	Cl	F	H	Cl
3829	Br	Cl	F	H	Br
3830	Br	Cl	F	H	F
3831	Br	Cl	F	CH ₃	H
3832	Br	Cl	F	CH ₃	CH ₃
3833	Br	Cl	F	CH ₃	OCH ₃
3834	Br	Cl	F	CH ₃	Cl
3835	Br	Cl	F	CH ₃	Br
3836	Br	Cl	F	OCH ₃	H
3837	Br	Cl	F	OCH ₃	CH ₃
3838	Br	Cl	F	OCH ₃	OCH ₃
3839	Br	Cl	F	OCH ₃	Cl
3840	Br	Cl	F	OCH ₃	Br
3841	Br	Cl	F	Cl	H
3842	Br	Cl	F	Cl	CH ₃
3843	Br	Cl	F	Cl	OCH ₃
3844	Br	Cl	F	Cl	Cl
3845	Br	Cl	F	Cl	Br
3846	Br	Cl	F	Br	H
3847	Br	Cl	F	Br	CH ₃

10

20

30

40

【表2-93】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3848	Br	Cl	F	Br	OCH ₃
3849	Br	Cl	F	Br	Cl
3850	Br	Cl	F	Br	Br
3851	Br	Cl	F	F	H
3852	Br	Cl	F	F	CH ₃
3853	Br	Cl	F	F	OCH ₃
3854	Br	Cl	F	F	Cl
3855	Br	Cl	F	F	Br
3856	Br	Cl	F	F	F
3857	Br	Br	CH ₃	H	H
3858	Br	Br	CH ₃	H	CH ₃
3859	Br	Br	CH ₃	H	OCH ₃
3860	Br	Br	CH ₃	H	Cl
3861	Br	Br	CH ₃	H	Br
3862	Br	Br	CH ₃	H	F
3863	Br	Br	CH ₃	CH ₃	H
3864	Br	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃
3865	Br	Br	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
3866	Br	Br	CH ₃	CH ₃	Cl
3867	Br	Br	CH ₃	CH ₃	Br
3868	Br	Br	CH ₃	CH ₃	F
3869	Br	Br	CH ₃	OCH ₃	H
3870	Br	Br	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
3871	Br	Br	CH ₃	OCH ₃	Cl
3872	Br	Br	CH ₃	OCH ₃	Br
3873	Br	Br	CH ₃	OCH ₃	F
3874	Br	Br	CH ₃	Cl	H
3875	Br	Br	CH ₃	Cl	OCH ₃
3876	Br	Br	CH ₃	Cl	Cl
3877	Br	Br	CH ₃	Cl	Br
3878	Br	Br	CH ₃	Cl	F
3879	Br	Br	CH ₃	Br	H
3880	Br	Br	CH ₃	Br	OCH ₃
3881	Br	Br	CH ₃	Br	Cl
3882	Br	Br	CH ₃	Br	Br
3883	Br	Br	CH ₃	Br	F
3884	Br	Br	CH ₃	F	H
3885	Br	Br	CH ₃	F	OCH ₃
3886	Br	Br	CH ₃	F	Cl
3887	Br	Br	CH ₃	F	Br

10

20

30

40

【表2-94】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3888	Br	Br	CH ₃	F	F
3889	Br	Br	OCH ₃	H	H
3890	Br	Br	OCH ₃	H	CH ₃
3891	Br	Br	OCH ₃	H	OCH ₃
3892	Br	Br	OCH ₃	H	Cl
3893	Br	Br	OCH ₃	H	Br
3894	Br	Br	OCH ₃	H	F
3895	Br	Br	OCH ₃	CH ₃	H
3896	Br	Br	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
3897	Br	Br	OCH ₃	CH ₃	Cl
3898	Br	Br	OCH ₃	CH ₃	Br
3899	Br	Br	OCH ₃	CH ₃	F
3900	Br	Br	OCH ₃	OCH ₃	H
3901	Br	Br	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
3902	Br	Br	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
3903	Br	Br	OCH ₃	OCH ₃	Cl
3904	Br	Br	OCH ₃	OCH ₃	Br
3905	Br	Br	OCH ₃	OCH ₃	F
3906	Br	Br	OCH ₃	Cl	H
3907	Br	Br	OCH ₃	Cl	CH ₃
3908	Br	Br	OCH ₃	Cl	Cl
3909	Br	Br	OCH ₃	Cl	Br
3910	Br	Br	OCH ₃	Cl	F
3911	Br	Br	OCH ₃	Br	H
3912	Br	Br	OCH ₃	Br	CH ₃
3913	Br	Br	OCH ₃	Br	Cl
3914	Br	Br	OCH ₃	Br	Br
3915	Br	Br	OCH ₃	Br	F
3916	Br	Br	OCH ₃	F	H
3917	Br	Br	OCH ₃	F	CH ₃
3918	Br	Br	OCH ₃	F	Cl
3919	Br	Br	OCH ₃	F	Br
3920	Br	Br	OCH ₃	F	F
3921	Br	Br	Cl	H	H
3922	Br	Br	Cl	H	CH ₃
3923	Br	Br	Cl	H	OCH ₃
3924	Br	Br	Cl	H	Cl
3925	Br	Br	Cl	H	Br
3926	Br	Br	Cl	H	F
3927	Br	Br	Cl	CH ₃	H

10

20

30

40

【表2-95】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
3928	Br	Br	Cl	CH ₃	CH ₃
3929	Br	Br	Cl	CH ₃	OCH ₃
3930	Br	Br	Cl	CH ₃	Br
3931	Br	Br	Cl	CH ₃	F
3932	Br	Br	Cl	OCH ₃	H
3933	Br	Br	Cl	OCH ₃	CH ₃
3934	Br	Br	Cl	OCH ₃	OCH ₃
3935	Br	Br	Cl	OCH ₃	Br
3936	Br	Br	Cl	OCH ₃	F
3937	Br	Br	Cl	Cl	H
3938	Br	Br	Cl	Cl	CH ₃
3939	Br	Br	Cl	Cl	OCH ₃
3940	Br	Br	Cl	Cl	Cl
3941	Br	Br	Cl	Cl	Br
3942	Br	Br	Cl	Cl	F
3943	Br	Br	Cl	Br	H
3944	Br	Br	Cl	Br	CH ₃
3945	Br	Br	Cl	Br	OCH ₃
3946	Br	Br	Cl	Br	Br
3947	Br	Br	Cl	F	H
3948	Br	Br	Cl	F	CH ₃
3949	Br	Br	Cl	F	OCH ₃
3950	Br	Br	Cl	F	Br
3951	Br	Br	Cl	F	F
3952	Br	Br	Br	H	H
3953	Br	Br	Br	H	CH ₃
3954	Br	Br	Br	H	OCH ₃
3955	Br	Br	Br	H	Cl
3956	Br	Br	Br	H	Br
3957	Br	Br	Br	H	F
3958	Br	Br	Br	CH ₃	H
3959	Br	Br	Br	CH ₃	CH ₃
3960	Br	Br	Br	CH ₃	OCH ₃
3961	Br	Br	Br	CH ₃	Cl
3962	Br	Br	Br	CH ₃	F
3963	Br	Br	Br	OCH ₃	H
3964	Br	Br	Br	OCH ₃	CH ₃
3965	Br	Br	Br	OCH ₃	OCH ₃
3966	Br	Br	Br	OCH ₃	Cl
3967	Br	Br	Br	OCH ₃	F

10

20

30

40

【表2-96】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c} R	R ^{2d}	R ^{2e}
3968	Br	Br	Br		H
3969	Br	Br	Br	Cl	CH ₃
3970	Br	Br	Br	Cl	OCH ₃
3971	Br	Br	Br	Cl	Cl
3972	Br	Br	Br	Cl	F
3973	Br	Br	Br	Br	H
3974	Br	Br	Br	Br	CH ₃
3975	Br	Br	Br	Br	OCH ₃
3976	Br	Br	Br	Br	Cl
3977	Br	Br	Br	Br	Br
3978	Br	Br	Br	Br	F
3979	Br	Br	Br	F	H
3980	Br	Br	Br	F	CH ₃
3981	Br	Br	Br	F	OCH ₃
3982	Br	Br	Br	F	Cl
3983	Br	Br	Br	F	F
3984	Br	Br	F	H	H
3985	Br	Br	F	H	CH ₃
3986	Br	Br	F	H	OCH ₃
3987	Br	Br	F	H	Cl
3988	Br	Br	F	H	Br
3989	Br	Br	F	H	F
3990	Br	Br	F	CH ₃	H
3991	Br	Br	F	CH ₃	CH ₃
3992	Br	Br	F	CH ₃	OCH ₃
3993	Br	Br	F	CH ₃	Cl
3994	Br	Br	F	CH ₃	Br
3995	Br	Br	F	OCH ₃	H
3996	Br	Br	F	OCH ₃	CH ₃
3997	Br	Br	F	OCH ₃	OCH ₃
3998	Br	Br	F	OCH ₃	Cl
3999	Br	Br	F	OCH ₃	Br
4000	Br	Br	F	Cl	H
4001	Br	Br	F	Cl	CH ₃
4002	Br	Br	F	Cl	OCH ₃
4003	Br	Br	F	Cl	Cl
4004	Br	Br	F	Cl	Br
4005	Br	Br	F	Br	H
4006	Br	Br	F	Br	CH ₃
4007	Br	Br	F	Br	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-97】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4008	Br	Br	F	Br	Cl
4009	Br	Br	F	Br	Br
4010	Br	Br	F	F	H
4011	Br	Br	F	F	CH ₃
4012	Br	Br	F	F	OCH ₃
4013	Br	Br	F	F	Cl
4014	Br	Br	F	F	Br
4015	Br	Br	F	F	F
4016	Br	F	CH ₃	H	H
4017	Br	F	CH ₃	H	CH ₃
4018	Br	F	CH ₃	H	OCH ₃
4019	Br	F	CH ₃	H	Cl
4020	Br	F	CH ₃	H	Br
4021	Br	F	CH ₃	H	F
4022	Br	F	CH ₃	CH ₃	H
4023	Br	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
4024	Br	F	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
4025	Br	F	CH ₃	CH ₃	Cl
4026	Br	F	CH ₃	CH ₃	Br
4027	Br	F	CH ₃	CH ₃	F
4028	Br	F	CH ₃	OCH ₃	H
4029	Br	F	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
4030	Br	F	CH ₃	OCH ₃	Cl
4031	Br	F	CH ₃	OCH ₃	Br
4032	Br	F	CH ₃	OCH ₃	F
4033	Br	F	CH ₃	Cl	H
4034	Br	F	CH ₃	Cl	OCH ₃
4035	Br	F	CH ₃	Cl	Cl
4036	Br	F	CH ₃	Cl	Br
4037	Br	F	CH ₃	Cl	F
4038	Br	F	CH ₃	Br	H
4039	Br	F	CH ₃	Br	OCH ₃
4040	Br	F	CH ₃	Br	Cl
4041	Br	F	CH ₃	Br	Br
4042	Br	F	CH ₃	Br	F
4043	Br	F	CH ₃	F	H
4044	Br	F	CH ₃	F	OCH ₃
4045	Br	F	CH ₃	F	Cl
4046	Br	F	CH ₃	F	Br
4047	Br	F	CH ₃	F	F

10

20

30

40

【表2-98】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4048	Br	F	OCH ₃	H	H
4049	Br	F	OCH ₃	H	CH ₃
4050	Br	F	OCH ₃	H	OCH ₃
4051	Br	F	OCH ₃	H	Cl
4052	Br	F	OCH ₃	H	Br
4053	Br	F	OCH ₃	H	F
4054	Br	F	OCH ₃	CH ₃	H
4055	Br	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
4056	Br	F	OCH ₃	CH ₃	Cl
4057	Br	F	OCH ₃	CH ₃	Br
4058	Br	F	OCH ₃	CH ₃	F
4059	Br	F	OCH ₃	OCH ₃	H
4060	Br	F	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
4061	Br	F	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
4062	Br	F	OCH ₃	OCH ₃	Cl
4063	Br	F	OCH ₃	OCH ₃	Br
4064	Br	F	OCH ₃	OCH ₃	F
4065	Br	F	OCH ₃	Cl	H
4066	Br	F	OCH ₃	Cl	CH ₃
4067	Br	F	OCH ₃	Cl	Cl
4068	Br	F	OCH ₃	Cl	Br
4069	Br	F	OCH ₃	Cl	F
4070	Br	F	OCH ₃	Br	H
4071	Br	F	OCH ₃	Br	CH ₃
4072	Br	F	OCH ₃	Br	Cl
4073	Br	F	OCH ₃	Br	Br
4074	Br	F	OCH ₃	Br	F
4075	Br	F	OCH ₃	F	H
4076	Br	F	OCH ₃	F	CH ₃
4077	Br	F	OCH ₃	F	Cl
4078	Br	F	OCH ₃	F	Br
4079	Br	F	OCH ₃	F	F
4080	Br	F	Cl	H	H
4081	Br	F	Cl	H	CH ₃
4082	Br	F	Cl	H	OCH ₃
4083	Br	F	Cl	H	Cl
4084	Br	F	Cl	H	Br
4085	Br	F	Cl	H	F
4086	Br	F	Cl	CH ₃	H
4087	Br	F	Cl	CH ₃	CH ₃

10

20

30

40

【表2-99】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4088	Br	F	Cl	CH ₃	OCH ₃
4089	Br	F	Cl	CH ₃	Br
4090	Br	F	Cl	CH ₃	F
4091	Br	F	Cl	OCH ₃	H
4092	Br	F	Cl	OCH ₃	CH ₃
4093	Br	F	Cl	OCH ₃	OCH ₃
4094	Br	F	Cl	OCH ₃	Br
4095	Br	F	Cl	OCH ₃	F
4096	Br	F	Cl	Cl	H
4097	Br	F	Cl	Cl	CH ₃
4098	Br	F	Cl	Cl	OCH ₃
4099	Br	F	Cl	Cl	Cl
4100	Br	F	Cl	Cl	Br
4101	Br	F	Cl	Cl	F
4102	Br	F	Cl	Br	H
4103	Br	F	Cl	Br	CH ₃
4104	Br	F	Cl	Br	OCH ₃
4105	Br	F	Cl	Br	Br
4106	Br	F	Cl	F	H
4107	Br	F	Cl	F	CH ₃
4108	Br	F	Cl	F	OCH ₃
4109	Br	F	Cl	F	Br
4110	Br	F	Cl	F	F
4111	Br	F	Br	H	H
4112	Br	F	Br	H	CH ₃
4113	Br	F	Br	H	OCH ₃
4114	Br	F	Br	H	Cl
4115	Br	F	Br	H	Br
4116	Br	F	Br	H	F
4117	Br	F	Br	CH ₃	H
4118	Br	F	Br	CH ₃	CH ₃
4119	Br	F	Br	CH ₃	OCH ₃
4120	Br	F	Br	CH ₃	Cl
4121	Br	F	Br	CH ₃	F
4122	Br	F	Br	OCH ₃	H
4123	Br	F	Br	OCH ₃	CH ₃
4124	Br	F	Br	OCH ₃	OCH ₃
4125	Br	F	Br	OCH ₃	Cl
4126	Br	F	Br	OCH ₃	F
4127	Br	F	Br	Cl	H

10

20

30

40

【表2-100】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4128	Br	F	Br	Cl	CH ₃
4129	Br	F	Br	Cl	OCH ₃
4130	Br	F	Br	Cl	Cl
4131	Br	F	Br	Cl	F
4132	Br	F	Br	Br	H
4133	Br	F	Br	Br	CH ₃
4134	Br	F	Br	Br	OCH ₃
4135	Br	F	Br	Br	Cl
4136	Br	F	Br	Br	Br
4137	Br	F	Br	Br	F
4138	Br	F	Br	F	H
4139	Br	F	Br	F	CH ₃
4140	Br	F	Br	F	OCH ₃
4141	Br	F	Br	F	Cl
4142	Br	F	Br	F	F
4143	Br	F	F	H	H
4144	Br	F	F	H	CH ₃
4145	Br	F	F	H	OCH ₃
4146	Br	F	F	H	Cl
4147	Br	F	F	H	Br
4148	Br	F	F	H	F
4149	Br	F	F	CH ₃	H
4150	Br	F	F	CH ₃	CH ₃
4151	Br	F	F	CH ₃	OCH ₃
4152	Br	F	F	CH ₃	Cl
4153	Br	F	F	CH ₃	Br
4154	Br	F	F	OCH ₃	H
4155	Br	F	F	OCH ₃	CH ₃
4156	Br	F	F	OCH ₃	OCH ₃
4157	Br	F	F	OCH ₃	Cl
4158	Br	F	F	OCH ₃	Br
4159	Br	F	F	Cl	H
4160	Br	F	F	Cl	CH ₃
4161	Br	F	F	Cl	OCH ₃
4162	Br	F	F	Cl	Cl
4163	Br	F	F	Cl	Br
4164	Br	F	F	Br	H
4165	Br	F	F	Br	CH ₃
4166	Br	F	F	Br	OCH ₃
4167	Br	F	F	Br	Cl

10

20

30

40

【表2-101】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4168	Br	F	F	Br	Br
4169	Br	F	F	F	H
4170	Br	F	F	F	CH ₃
4171	Br	F	F	F	OCH ₃
4172	Br	F	F	F	Cl
4173	Br	F	F	F	Br
4174	Br	F	F	F	F
4175	F	CH ₃	CH ₃	H	H
4176	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
4177	F	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
4178	F	CH ₃	CH ₃	Cl	H
4179	F	CH ₃	CH ₃	Br	H
4180	F	CH ₃	CH ₃	F	H
4181	F	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
4182	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
4183	F	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃
4184	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
4185	F	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
4186	F	CH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃
4187	F	CH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃
4188	F	CH ₃	CH ₃	F	OCH ₃
4189	F	CH ₃	CH ₃	H	Cl
4190	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
4191	F	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl
4192	F	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl
4193	F	CH ₃	CH ₃	Br	Cl
4194	F	CH ₃	CH ₃	F	Cl
4195	F	CH ₃	CH ₃	H	Br
4196	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
4197	F	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br
4198	F	CH ₃	CH ₃	Cl	Br
4199	F	CH ₃	CH ₃	Br	Br
4200	F	CH ₃	CH ₃	F	Br
4201	F	CH ₃	CH ₃	H	F
4202	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F
4203	F	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	F
4204	F	CH ₃	CH ₃	Cl	F
4205	F	CH ₃	CH ₃	Br	F
4206	F	CH ₃	CH ₃	F	F
4207	F	CH ₃	OCH ₃	H	H

10

20

30

40

【表2-102】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4208	F	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
4209	F	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H
4210	F	CH ₃	OCH ₃	Cl	H
4211	F	CH ₃	OCH ₃	Br	H
4212	F	CH ₃	OCH ₃	F	H
4213	F	CH ₃	OCH ₃	H	CH ₃
4214	F	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
4215	F	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
4216	F	CH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃
4217	F	CH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃
4218	F	CH ₃	OCH ₃	F	CH ₃
4219	F	CH ₃	OCH ₃	H	OCH ₃
4220	F	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
4221	F	CH ₃	OCH ₃	H	Cl
4222	F	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl
4223	F	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl
4224	F	CH ₃	OCH ₃	Cl	Cl
4225	F	CH ₃	OCH ₃	Br	Cl
4226	F	CH ₃	OCH ₃	F	Cl
4227	F	CH ₃	OCH ₃	H	Br
4228	F	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br
4229	F	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br
4230	F	CH ₃	OCH ₃	Cl	Br
4231	F	CH ₃	OCH ₃	Br	Br
4232	F	CH ₃	OCH ₂	F	Br
4233	F	CH ₃	OCH ₃	H	F
4234	F	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	F
4235	F	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F
4236	F	CH ₃	OCH ₃	Cl	F
4237	F	CH ₃	OCH ₃	Br	F
4238	F	CH ₃	OCH ₃	F	F
4239	F	CH ₃	Cl	H	H
4240	F	CH ₃	Cl	CH ₃	H
4241	F	CH ₃	Cl	OCH ₃	H
4242	F	CH ₃	Cl	Cl	H
4243	F	CH ₃	Cl	Br	H
4244	F	CH ₃	Cl	F	H
4245	F	CH ₃	Cl	H	CH ₃
4246	F	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
4247	F	CH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃

10

20

30

40

【表2-103】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4248	F	CH ₃	Cl	Cl	CH ₃
4249	F	CH ₃	Cl	Br	CH ₃
4250	F	CH ₃	Cl	F	CH ₃
4251	F	CH ₃	Cl	H	OCH ₃
4252	F	CH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃
4253	F	CH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃
4254	F	CH ₃	Cl	Cl	OCH ₃
4255	F	CH ₃	Cl	Br	OCH ₃
4256	F	CH ₃	Cl	F	OCH ₃
4257	F	CH ₃	Cl	H	Cl
4258	F	CH ₃	Cl	Cl	Cl
4259	F	CH ₃	Cl	H	Br
4260	F	CH ₃	Cl	CH ₃	Br
4261	F	CH ₃	Cl	OCH ₃	Br
4262	F	CH ₃	Cl	Cl	Br
4263	F	CH ₃	Cl	Br	Br
4264	F	CH ₃	Cl	F	Br
4265	F	CH ₃	Cl	H	F
4266	F	CH ₃	Cl	CH ₃	F
4267	F	CH ₃	Cl	OCH ₃	F
4268	F	CH ₃	Cl	Cl	F
4269	F	CH ₃	Cl	F	F
4270	F	CH ₃	Br	H	H
4271	F	CH ₃	Br	CH ₃	H
4272	F	CH ₃	Br	OCH ₃	H
4273	F	CH ₃	Br	Cl	H
4274	F	CH ₃	Br	Br	H
4275	F	CH ₃	Br	F	H
4276	F	CH ₃	Br	H	CH ₃
4277	F	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃
4278	F	CH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃
4279	F	CH ₃	Br	Cl	CH ₃
4280	F	CH ₃	Br	Br	CH ₃
4281	F	CH ₃	Br	F	CH ₃
4282	F	CH ₃	Br	H	OCH ₃
4283	F	CH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃
4284	F	CH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃
4285	F	CH ₃	Br	Cl	OCH ₃
4286	F	CH ₃	Br	Br	OCH ₃
4287	F	CH ₃	Br	F	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-104】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4288	F	CH ₃	Br	H	Cl
4289	F	CH ₃	Br	CH ₃	Cl
4290	F	CH ₃	Br	OCH ₃	Cl
4291	F	CH ₃	Br	Cl	Cl
4292	F	CH ₃	Br	Br	Cl
4293	F	CH ₃	Br	F	Cl
4294	F	CH ₃	Br	H	Br
4295	F	CH ₃	Br	Br	Br
4296	F	CH ₃	Br	H	F
4297	F	CH ₃	Br	CH ₃	F
4298	F	CH ₃	Br	OCH ₃	F
4299	F	CH ₃	Br	Cl	F
4300	F	CH ₃	Br	Br	F
4301	F	CH ₃	Br	F	F
4302	F	CH ₃	F	H	H
4303	F	CH ₃	F	CH ₃	H
4304	F	CH ₃	F	OCH ₃	H
4305	F	CH ₃	F	Cl	H
4306	F	CH ₃	F	Br	H
4307	F	CH ₃	F	F	H
4308	F	CH ₃	F	H	CH ₃
4309	F	CH ₃	F	CH ₃	CH ₃
4310	F	CH ₃	F	OCH ₃	CH ₃
4311	F	CH ₃	F	Cl	CH ₃
4312	F	CH ₃	F	Br	CH ₃
4313	F	CH ₃	F	F	CH ₃
4314	F	CH ₃	F	H	OCH ₃
4315	F	CH ₃	F	CH ₃	OCH ₃
4316	F	CH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃
4317	F	CH ₃	F	Cl	OCH ₃
4318	F	CH ₃	F	Br	OCH ₃
4319	F	CH ₃	F	F	OCH ₃
4320	F	CH ₃	F	H	Cl
4321	F	CH ₃	F	CH ₃	Cl
4322	F	CH ₃	F	OCH ₃	Cl
4323	F	CH ₃	F	Cl	Cl
4324	F	CH ₃	F	Br	Cl
4325	F	CH ₃	F	F	Cl
4326	F	CH ₃	F	H	Br
4327	F	CH ₃	F	CH ₃	Br

10

20

30

40

【表2-105】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4328	F	CH ₃	F	OCH ₃	Br
4329	F	CH ₃	F	Cl	Br
4330	F	CH ₃	F	Br	Br
4331	F	CH ₃	F	F	Br
4332	F	CH ₃	F	H	F
4333	F	CH ₃	F	F	F
4334	F	OCH ₃	CH ₃	H	H
4335	F	OCH ₃	CH ₃	H	CH ₃
4336	F	OCH ₃	CH ₃	H	OCH ₃
4337	F	OCH ₃	CH ₃	H	Cl
4338	F	OCH ₃	CH ₃	H	Br
4339	F	OCH ₃	CH ₃	H	F
4340	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H
4341	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
4342	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
4343	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
4344	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
4345	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	F
4346	F	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
4347	F	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
4348	F	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Cl
4349	F	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Br
4350	F	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	F
4351	F	OCH ₃	CH ₃	Cl	H
4352	F	OCH ₃	CH ₃	Cl	OCH ₃
4353	F	OCH ₃	CH ₃	Cl	Cl
4354	F	OCH ₃	CH ₃	Cl	Br
4355	F	OCH ₃	CH ₃	Cl	F
4356	F	OCH ₃	CH ₃	Br	H
4357	F	OCH ₃	CH ₃	Br	OCH ₃
4358	F	OCH ₃	CH ₃	Br	Cl
4359	F	OCH ₃	CH ₃	Br	Br
4360	F	OCH ₃	CH ₃	Br	F
4361	F	OCH ₃	CH ₃	F	H
4362	F	OCH ₃	CH ₃	F	OCH ₃
4363	F	OCH ₃	CH ₃	F	Cl
4364	F	OCH ₃	CH ₃	F	Br
4365	F	OCH ₃	CH ₃	F	F
4366	F	OCH ₃	OCH ₃	H	H
4367	F	OCH ₃	OCH ₃	H	CH ₃

10

20

30

40

【表2-106】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4368	F	OCH ₃	OCH ₃	H	OCH ₃
4369	F	OCH ₃	OCH ₃	H	Cl
4370	F	OCH ₃	OCH ₃	H	Br
4371	F	OCH ₃	OCH ₃	H	F
4372	F	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
4373	F	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
4374	F	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Cl
4375	F	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	Br
4376	F	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	F
4377	F	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H
4378	F	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
4379	F	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
4380	F	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Cl
4381	F	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	Br
4382	F	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	F
4383	F	OCH ₃	OCH ₃	Cl	H
4384	F	OCH ₃	OCH ₃	Cl	CH ₃
4385	F	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Cl
4386	F	OCH ₃	OCH ₃	Cl	Br
4387	F	OCH ₃	OCH ₃	Cl	F
4388	F	OCH ₃	OCH ₃	Br	H
4389	F	OCH ₃	OCH ₃	Br	CH ₃
4390	F	OCH ₃	OCH ₃	Br	Cl
4391	F	OCH ₃	OCH ₃	Br	Br
4392	F	OCH ₃	OCH ₃	Br	F
4393	F	OCH ₃	OCH ₃	F	H
4394	F	OCH ₃	OCH ₃	F	CH ₃
4395	F	OCH ₃	OCH ₃	F	Cl
4396	F	OCH ₃	OCH ₃	F	Br
4397	F	OCH ₃	OCH ₃	F	F
4398	F	OCH ₃	Cl	H	H
4399	F	OCH ₃	Cl	H	CH ₃
4400	F	OCH ₃	Cl	H	OCH ₃
4401	F	OCH ₃	Cl	H	Cl
4402	F	OCH ₃	Cl	H	Br
4403	F	OCH ₃	Cl	H	F
4404	F	OCH ₃	Cl	CH ₃	H
4405	F	OCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
4406	F	OCH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃
4407	F	OCH ₃	Cl	CH ₃	Br

10

20

30

40

【表2-107】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4408	F	OCH ₃	Cl	CH ₃	F
4409	F	OCH ₃	Cl	OCH ₃	H
4410	F	OCH ₃	Cl	OCH ₃	CH ₃
4411	F	OCH ₃	Cl	OCH ₃	OCH ₃
4412	F	OCH ₃	Cl	OCH ₃	Br
4413	F	OCH ₃	Cl	OCH ₃	F
4414	F	OCH ₃	Cl	Cl	H
4415	F	OCH ₃	Cl	Cl	CH ₃
4416	F	OCH ₃	Cl	Cl	OCH ₃
4417	F	OCH ₃	Cl	Cl	Cl
4418	F	OCH ₃	Cl	Cl	Br
4419	F	OCH ₃	Cl	Cl	F
4420	F	OCH ₃	Cl	Br	H
4421	F	OCH ₃	Cl	Br	CH ₃
4422	F	OCH ₃	Cl	Br	OCH ₃
4423	F	OCH ₃	Cl	Br	Br
4424	F	OCH ₃	Cl	F	H
4425	F	OCH ₃	Cl	F	CH ₃
4426	F	OCH ₃	Cl	F	OCH ₃
4427	F	OCH ₃	Cl	F	Br
4428	F	OCH ₃	Cl	F	F
4429	F	OCH ₃	Br	H	H
4430	F	OCH ₃	Br	H	CH ₃
4431	F	OCH ₃	Br	H	OCH ₃
4432	F	OCH ₃	Br	H	Cl
4433	F	OCH ₃	Br	H	Br
4434	F	OCH ₃	Br	H	F
4435	F	OCH ₃	Br	CH ₃	H
4436	F	OCH ₃	Br	CH ₃	CH ₃
4437	F	OCH ₃	Br	CH ₃	OCH ₃
4438	F	OCH ₃	Br	CH ₃	Cl
4439	F	OCH ₃	Br	CH ₃	F
4440	F	OCH ₃	Br	OCH ₃	H
4441	F	OCH ₃	Br	OCH ₃	CH ₃
4442	F	OCH ₃	Br	OCH ₃	OCH ₃
4443	F	OCH ₃	Br	OCH ₃	Cl
4444	F	OCH ₃	Br	OCH ₃	F
4445	F	OCH ₃	Br	Cl	H
4446	F	OCH ₃	Br	Cl	CH ₃
4447	F	OCH ₃	Br	Cl	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-108】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4448	F	OCH ₃	Br	Cl	Cl
4449	F	OCH ₃	Br	Cl	F
4450	F	OCH ₃	Br	Br	H
4451	F	OCH ₃	Br	Br	CH ₃
4452	F	OCH ₃	Br	Br	OCH ₃
4453	F	OCH ₃	Br	Br	Cl
4454	F	OCH ₃	Br	Br	Br
4455	F	OCH ₃	Br	Br	F
4456	F	OCH ₃	Br	F	H
4457	F	OCH ₃	Br	F	CH ₃
4458	F	OCH ₃	Br	F	OCH ₃
4459	F	OCH ₃	Br	F	Cl
4460	F	OCH ₃	Br	F	F
4461	F	OCH ₃	F	H	H
4462	F	OCH ₃	F	H	CH ₃
4463	F	OCH ₃	F	H	OCH ₃
4464	F	OCH ₃	F	H	Cl
4465	F	OCH ₃	F	H	Br
4466	F	OCH ₃	F	H	F
4467	F	OCH ₃	F	CH ₃	H
4468	F	OCH ₃	F	CH ₃	CH ₃
4469	F	OCH ₃	F	CH ₃	OCH ₃
4470	F	OCH ₃	F	CH ₃	Cl
4471	F	OCH ₃	F	CH ₃	Br
4472	F	OCH ₃	F	OCH ₃	H
4473	F	OCH ₃	F	OCH ₃	CH ₃
4474	F	OCH ₃	F	OCH ₃	OCH ₃
4475	F	OCH ₃	F	OCH ₃	Cl
4476	F	OCH ₃	F	OCH ₃	Br
4477	F	OCH ₃	F	Cl	H
4478	F	OCH ₃	F	Cl	CH ₃
4479	F	OCH ₃	F	Cl	OCH ₃
4480	F	OCH ₃	F	Cl	Cl
4481	F	OCH ₃	F	Cl	Br
4482	F	OCH ₃	F	Br	H
4483	F	OCH ₃	F	Br	CH ₃
4484	F	OCH ₃	F	Br	OCH ₃
4485	F	OCH ₃	F	Br	Cl
4486	F	OCH ₃	F	Br	Br
4487	F	OCH ₃	F	F	H

10

20

30

40

【表2-109】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4488	F	OCH ₃	F	F	CH ₃
4489	F	OCH ₃	F	F	OCH ₃
4490	F	OCH ₃	F	F	Cl
4491	F	OCH ₃	F	F	Br
4492	F	OCH ₃	F	F	F
4493	F	Cl	CH ₃	H	H
4494	F	Cl	CH ₃	H	CH ₃
4495	F	Cl	CH ₃	H	OCH ₃
4496	F	Cl	CH ₃	H	Cl
4497	F	Cl	CH ₃	H	Br
4498	F	Cl	CH ₃	H	F
4499	F	Cl	CH ₃	CH ₃	H
4500	F	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
4501	F	Cl	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
4502	F	Cl	CH ₃	CH ₃	Cl
4503	F	Cl	CH ₃	CH ₃	Br
4504	F	Cl	CH ₃	CH ₃	F
4505	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	H
4506	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
4507	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	Cl
4508	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	Br
4509	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	F
4510	F	Cl	CH ₃	Cl	H
4511	F	Cl	CH ₃	Cl	OCH ₃
4512	F	Cl	CH ₃	Cl	Cl
4513	F	Cl	CH ₃	Cl	Br
4514	F	Cl	CH ₃	Cl	F
4515	F	Cl	CH ₃	Br	H
4516	F	Cl	CH ₃	Br	OCH ₃
4517	F	Cl	CH ₃	Br	Cl
4518	F	Cl	CH ₃	Br	Br
4519	F	Cl	CH ₃	Br	F
4520	F	Cl	CH ₃	F	H
4521	F	Cl	CH ₃	F	OCH ₃
4522	F	Cl	CH ₃	F	Cl
4523	F	Cl	CH ₃	F	Br
4524	F	Cl	CH ₃	F	F
4525	F	Cl	OCH ₃	H	H
4526	F	Cl	OCH ₃	H	CH ₃
4527	F	Cl	OCH ₃	H	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-110】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4528	F	Cl	OCH ₃	H	Cl
4529	F	Cl	OCH ₃	H	Br
4530	F	Cl	OCH ₃	H	F
4531	F	Cl	OCH ₃	CH ₃	H
4532	F	Cl	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
4533	F	Cl	OCH ₃	CH ₃	Cl
4534	F	Cl	OCH ₃	CH ₃	Br
4535	F	Cl	OCH ₃	CH ₃	F
4536	F	Cl	OCH ₃	OCH ₃	H
4537	F	Cl	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
4538	F	Cl	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
4539	F	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Cl
4540	F	Cl	OCH ₃	OCH ₃	Br
4541	F	Cl	OCH ₃	OCH ₃	F
4542	F	Cl	OCH ₃	Cl	H
4543	F	Cl	OCH ₃	Cl	CH ₃
4544	F	Cl	OCH ₃	Cl	Cl
4545	F	Cl	OCH ₃	Cl	Br
4546	F	Cl	OCH ₃	Cl	F
4547	F	Cl	OCH ₃	Br	H
4548	F	Cl	OCH ₃	Br	CH ₃
4549	F	Cl	OCH ₃	Br	Cl
4550	F	Cl	OCH ₃	Br	Br
4551	F	Cl	OCH ₃	Br	F
4552	F	Cl	OCH ₃	F	H
4553	F	Cl	OCH ₃	F	CH ₃
4554	F	Cl	OCH ₃	F	Cl
4555	F	Cl	OCH ₃	F	Br
4556	F	Cl	OCH ₃	F	F
4557	F	Cl	Cl	H	H
4558	F	Cl	Cl	H	CH ₃
4559	F	Cl	Cl	H	OCH ₃
4560	F	Cl	Cl	H	Cl
4561	F	Cl	Cl	H	Br
4562	F	Cl	Cl	H	F
4563	F	Cl	Cl	CH ₃	H
4564	F	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃
4565	F	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃
4566	F	Cl	Cl	CH ₃	Br
4567	F	Cl	Cl	CH ₃	F

10

20

30

40

【表2-111】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4568	F	Cl	Cl	OCH ₃	H
4569	F	Cl	Cl	OCH ₃	CH ₃
4570	F	Cl	Cl	OCH ₃	OCH ₃
4571	F	Cl	Cl	OCH ₃	Br
4572	F	Cl	Cl	OCH ₃	F
4573	F	Cl	Cl	Cl	H
4574	F	Cl	Cl	Cl	CH ₃
4575	F	Cl	Cl	Cl	OCH ₃
4576	F	Cl	Cl	Cl	Cl
4577	F	Cl	Cl	Cl	Br
4578	F	Cl	Cl	Cl	F
4579	F	Cl	Cl	Br	H
4580	F	Cl	Cl	Br	CH ₃
4581	F	Cl	Cl	Br	OCH ₃
4582	F	Cl	Cl	Br	Br
4583	F	Cl	Cl	F	H
4584	F	Cl	Cl	F	CH ₃
4585	F	Cl	Cl	F	OCH ₃
4586	F	Cl	Cl	F	Br
4587	F	Cl	Cl	F	F
4588	F	Cl	Br	H	H
4589	F	Cl	Br	H	CH ₃
4590	F	Cl	Br	H	OCH ₃
4591	F	Cl	Br	H	Cl
4592	F	Cl	Br	H	Br
4593	F	Cl	Br	H	F
4594	F	Cl	Br	CH ₃	H
4595	F	Cl	Br	CH ₃	CH ₃
4596	F	Cl	Br	CH ₃	OCH ₃
4597	F	Cl	Br	CH ₃	Cl
4598	F	Cl	Br	CH ₃	F
4599	F	Cl	Br	OCH ₃	H
4600	F	Cl	Br	OCH ₃	CH ₃
4601	F	Cl	Br	OCH ₃	OCH ₃
4602	F	Cl	Br	OCH ₃	Cl
4603	F	Cl	Br	OCH ₃	F
4604	F	Cl	Br	Cl	H
4605	F	Cl	Br	Cl	CH ₃
4606	F	Cl	Br	Cl	OCH ₃
4607	F	Cl	Br	Cl	Cl

10

20

30

40

【表2-112】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4608	F	Cl	Br	Cl	F
4609	F	Cl	Br	Br	H
4610	F	Cl	Br	Br	CH ₃
4611	F	Cl	Br	Br	OCH ₃
4612	F	Cl	Br	Br	Cl
4613	F	Cl	Br	Br	Br
4614	F	Cl	Br	Br	F
4615	F	Cl	Br	F	H
4616	F	Cl	Br	F	CH ₃
4617	F	Cl	Br	F	OCH ₃
4618	F	Cl	Br	F	Cl
4619	F	Cl	Br	F	F
4620	F	Cl	F	H	H
4621	F	Cl	F	H	CH ₃
4622	F	Cl	F	H	OCH ₃
4623	F	Cl	F	H	Cl
4624	F	Cl	F	H	Br
4625	F	Cl	F	H	F
4626	F	Cl	F	CH ₃	H
4627	F	Cl	F	CH ₃	CH ₃
4628	F	Cl	F	CH ₃	OCH ₃
4629	F	Cl	F	CH ₃	Cl
4630	F	Cl	F	CH ₃	Br
4631	F	Cl	F	OCH ₃	H
4632	F	Cl	F	OCH ₃	CH ₃
4633	F	Cl	F	OCH ₃	OCH ₃
4634	F	Cl	F	OCH ₃	Cl
4635	F	Cl	F	OCH ₃	Br
4636	F	Cl	F	Cl	H
4637	F	Cl	F	Cl	CH ₃
4638	F	Cl	F	Cl	OCH ₃
4639	F	Cl	F	Cl	Cl
4640	F	Cl	F	Cl	Br
4641	F	Cl	F	Br	H
4642	F	Cl	F	Br	CH ₃
4643	F	Cl	F	Br	OCH ₃
4644	F	Cl	F	Br	Cl
4645	F	Cl	F	Br	Br
4646	F	Cl	F	F	H
4647	F	Cl	F	F	CH ₃

10

20

30

40

【表2-113】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4648	F	Cl	F	F	OCH ₃
4649	F	Cl	F	F	Cl
4650	F	Cl	F	F	Br
4651	F	Cl	F	F	F
4652	F	Br	CH ₃	H	H
4653	F	Br	CH ₃	H	CH ₃
4654	F	Br	CH ₃	H	OCH ₃
4655	F	Br	CH ₃	H	Cl
4656	F	Br	CH ₃	H	Br
4657	F	Br	CH ₃	H	F
4658	F	Br	CH ₃	CH ₃	H
4659	F	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃
4660	F	Br	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
4661	F	Br	CH ₃	CH ₃	Cl
4662	F	Br	CH ₃	CH ₃	Br
4663	F	Br	CH ₃	CH ₃	F
4664	F	Br	CH ₃	OCH ₃	H
4665	F	Br	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
4666	F	Br	CH ₃	OCH ₃	Cl
4667	F	Br	CH ₃	OCH ₃	Br
4668	F	Br	CH ₃	OCH ₃	F
4669	F	Br	CH ₃	Cl	H
4670	F	Br	CH ₃	Cl	OCH ₃
4671	F	Br	CH ₃	Cl	Cl
4672	F	Br	CH ₃	Cl	Br
4673	F	Br	CH ₃	Cl	F
4674	F	Br	CH ₃	Br	H
4675	F	Br	CH ₃	Br	OCH ₃
4676	F	Br	CH ₃	Br	Cl
4677	F	Br	CH ₃	Br	Br
4678	F	Br	CH ₃	Br	F
4679	F	Br	CH ₃	F	H
4680	F	Br	CH ₃	F	OCH ₃
4681	F	Br	CH ₃	F	Cl
4682	F	Br	CH ₃	F	Br
4683	F	Br	CH ₃	F	F
4684	F	Br	OCH ₃	H	H
4685	F	Br	OCH ₃	H	CH ₃
4686	F	Br	OCH ₃	H	OCH ₃
4687	F	Br	OCH ₃	H	Cl

10

20

30

40

【表2-114】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4688	F	Br	OCH ₃	H	Br
4689	F	Br	OCH ₃	H	F
4690	F	Br	OCH ₃	CH ₃	H
4691	F	Br	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
4692	F	Br	OCH ₃	CH ₃	Cl
4693	F	Br	OCH ₃	CH ₃	Br
4694	F	Br	OCH ₃	CH ₃	F
4695	F	Br	OCH ₃	OCH ₃	H
4696	F	Br	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
4697	F	Br	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
4698	F	Br	OCH ₃	OCH ₃	Cl
4699	F	Br	OCH ₃	OCH ₃	Br
4700	F	Br	OCH ₃	OCH ₃	F
4701	F	Br	OCH ₃	Cl	H
4702	F	Br	OCH ₃	Cl	CH ₃
4703	F	Br	OCH ₃	Cl	Cl
4704	F	Br	OCH ₃	Cl	Br
4705	F	Br	OCH ₃	Cl	F
4706	F	Br	OCH ₃	Br	H
4707	F	Br	OCH ₃	Br	CH ₃
4708	F	Br	OCH ₃	Br	Cl
4709	F	Br	OCH ₃	Br	Br
4710	F	Br	OCH ₃	Br	F
4711	F	Br	OCH ₃	F	H
4712	F	Br	OCH ₃	F	CH ₃
4713	F	Br	OCH ₃	F	Cl
4714	F	Br	OCH ₃	F	Br
4715	F	Br	OCH ₃	F	F
4716	F	Br	Cl	H	H
4717	F	Br	Cl	H	CH ₃
4718	F	Br	Cl	H	OCH ₃
4719	F	Br	Cl	H	Cl
4720	F	Br	Cl	H	Br
4721	F	Br	Cl	H	F
4722	F	Br	Cl	CH ₃	H
4723	F	Br	Cl	CH ₃	CH ₃
4724	F	Br	Cl	CH ₃	OCH ₃
4725	F	Br	Cl	CH ₃	Br
4726	F	Br	Cl	CH ₃	F
4727	F	Br	Cl	OCH ₃	H

10

20

30

40

【表2-115】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4728	F	Br	Cl	OCH ₃	CH ₃
4729	F	Br	Cl	OCH ₃	OCH ₃
4730	F	Br	Cl	OCH ₃	Br
4731	F	Br	Cl	OCH ₃	F
4732	F	Br	Cl	Cl	H
4733	F	Br	Cl	Cl	CH ₃
4734	F	Br	Cl	Cl	OCH ₃
4735	F	Br	Cl	Cl	Cl
4736	F	Br	Cl	Cl	Br
4737	F	Br	Cl	Cl	F
4738	F	Br	Cl	Br	H
4739	F	Br	Cl	Br	CH ₃
4740	F	Br	Cl	Br	OCH ₃
4741	F	Br	Cl	Br	Br
4742	F	Br	Cl	F	H
4743	F	Br	Cl	F	CH ₃
4744	F	Br	Cl	F	OCH ₃
4745	F	Br	Cl	F	Br
4746	F	Br	Cl	F	F
4747	F	Br	Br	H	H
4748	F	Br	Br	H	CH ₃
4749	F	Br	Br	H	OCH ₃
4750	F	Br	Br	H	Cl
4751	F	Br	Br	H	Br
4752	F	Br	Br	H	F
4753	F	Br	Br	CH ₃	H
4754	F	Br	Br	CH ₃	CH ₃
4755	F	Br	Br	CH ₃	OCH ₃
4756	F	Br	Br	CH ₃	Cl
4757	F	Br	Br	CH ₃	F
4758	F	Br	Br	OCH ₃	H
4759	F	Br	Br	OCH ₃	CH ₃
4760	F	Br	Br	OCH ₃	OCH ₃
4761	F	Br	Br	OCH ₃	Cl
4762	F	Br	Br	OCH ₃	F
4763	F	Br	Br	Cl	H
4764	F	Br	Br	Cl	CH ₃
4765	F	Br	Br	Cl	OCH ₃
4766	F	Br	Br	Cl	Cl
4767	F	Br	Br	Cl	F

10

20

30

40

【表2-116】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4768	F	Br	Br	Br	H
4769	F	Br	Br	Br	CH ₃
4770	F	Br	Br	Br	OCH ₃
4771	F	Br	Br	Br	Cl
4772	F	Br	Br	Br	Br
4773	F	Br	Br	Br	F
4774	F	Br	Br	F	H
4775	F	Br	Br	F	CH ₃
4776	F	Br	Br	F	OCH ₃
4777	F	Br	Br	F	Cl
4778	F	Br	Br	F	F
4779	F	Br	F	H	H
4780	F	Br	F	H	CH ₃
4781	F	Br	F	H	OCH ₃
4782	F	Br	F	H	Cl
4783	F	Br	F	H	Br
4784	F	Br	F	H	F
4785	F	Br	F	CH ₃	H
4786	F	Br	F	CH ₃	CH ₃
4787	F	Br	F	CH ₃	OCH ₃
4788	F	Br	F	CH ₃	Cl
4789	F	Br	F	CH ₃	Br
4790	F	Br	F	OCH ₃	H
4791	F	Br	F	OCH ₃	CH ₃
4792	F	Br	F	OCH ₃	OCH ₃
4793	F	Br	F	OCH ₃	Cl
4794	F	Br	F	OCH ₃	Br
4795	F	Br	F	Cl	H
4796	F	Br	F	Cl	CH ₃
4797	F	Br	F	Cl	OCH ₃
4798	F	Br	F	Cl	Cl
4799	F	Br	F	Cl	Br
4800	F	Br	F	Br	H
4801	F	Br	F	Br	CH ₃
4802	F	Br	F	Br	OCH ₃
4803	F	Br	F	Br	Cl
4804	F	Br	F	Br	Br
4805	F	Br	F	F	H
4806	F	Br	F	F	CH ₃
4807	F	Br	F	F	OCH ₃

10

20

30

40

【表2-117】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4808	F	Br	F	F	Cl
4809	F	Br	F	F	Br
4810	F	Br	F	F	F
4811	F	F	CH ₃	H	H
4812	F	F	CH ₃	H	CH ₃
4813	F	F	CH ₃	H	OCH ₃
4814	F	F	CH ₃	H	Cl
4815	F	F	CH ₃	H	Br
4816	F	F	CH ₃	H	F
4817	F	F	CH ₃	CH ₃	H
4818	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃
4819	F	F	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
4820	F	F	CH ₃	CH ₃	Cl
4821	F	F	CH ₃	CH ₃	Br
4822	F	F	CH ₃	CH ₃	F
4823	F	F	CH ₃	OCH ₃	H
4824	F	F	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃
4825	F	F	CH ₃	OCH ₃	Cl
4826	F	F	CH ₃	OCH ₃	Br
4827	F	F	CH ₃	OCH ₃	F
4828	F	F	CH ₃	Cl	H
4829	F	F	CH ₃	Cl	OCH ₃
4830	F	F	CH ₃	Cl	Cl
4831	F	F	CH ₃	Cl	Br
4832	F	F	CH ₃	Cl	F
4833	F	F	CH ₃	Br	H
4834	F	F	CH ₃	Br	OCH ₃
4835	F	F	CH ₃	Br	Cl
4836	F	F	CH ₃	Br	Br
4837	F	F	CH ₃	Br	F
4838	F	F	CH ₃	F	H
4839	F	F	CH ₃	F	OCH ₃
4840	F	F	CH ₃	F	Cl
4841	F	F	CH ₃	F	Br
4842	F	F	CH ₃	F	F
4843	F	F	OCH ₃	H	H
4844	F	F	OCH ₃	H	CH ₃
4845	F	F	OCH ₃	H	OCH ₃
4846	F	F	OCH ₃	H	Cl
4847	F	F	OCH ₃	H	Br

10

20

30

40

【表2-118】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4848	F	F	OCH ₃	H	F
4849	F	F	OCH ₃	CH ₃	H
4850	F	F	OCH ₃	CH ₃	CH ₃
4851	F	F	OCH ₃	CH ₃	Cl
4852	F	F	OCH ₃	CH ₃	Br
4853	F	F	OCH ₃	CH ₃	F
4854	F	F	OCH ₃	OCH ₃	H
4855	F	F	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃
4856	F	F	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃
4857	F	F	OCH ₃	OCH ₃	Cl
4858	F	F	OCH ₃	OCH ₃	Br
4859	F	F	OCH ₃	OCH ₃	F
4860	F	F	OCH ₃	Cl	H
4861	F	F	OCH ₃	Cl	CH ₃
4862	F	F	OCH ₃	Cl	Cl
4863	F	F	OCH ₃	Cl	Br
4864	F	F	OCH ₃	Cl	F
4865	F	F	OCH ₃	Br	H
4866	F	F	OCH ₃	Br	CH ₃
4867	F	F	OCH ₃	Br	Cl
4868	F	F	OCH ₃	Br	Br
4869	F	F	OCH ₃	Br	F
4870	F	F	OCH ₃	F	H
4871	F	F	OCH ₃	F	CH ₃
4872	F	F	OCH ₃	F	Cl
4873	F	F	OCH ₃	F	Br
4874	F	F	OCH ₃	F	F
4875	F	F	Cl	H	H
4876	F	F	Cl	H	CH ₃
4877	F	F	Cl	H	OCH ₃
4878	F	F	Cl	H	Cl
4879	F	F	Cl	H	Br
4880	F	F	Cl	H	F
4881	F	F	Cl	CH ₃	H
4882	F	F	Cl	CH ₃	CH ₃
4883	F	F	Cl	CH ₃	OCH ₃
4884	F	F	Cl	CH ₃	Br
4885	F	F	Cl	CH ₃	F
4886	F	F	Cl	OCH ₃	H
4887	F	F	Cl	OCH ₃	CH ₃

10

20

30

40

【表2-119】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4888	F	F	Cl	OCH ₃	OCH ₃
4889	F	F	Cl	OCH ₃	Br
4890	F	F	Cl	OCH ₃	F
4891	F	F	Cl	Cl	H
4892	F	F	Cl	Cl	CH ₃
4893	F	F	Cl	Cl	OCH ₃
4894	F	F	Cl	Cl	Cl
4895	F	F	Cl	Cl	Br
4896	F	F	Cl	Cl	F
4897	F	F	Cl	Br	H
4898	F	F	Cl	Br	CH ₃
4899	F	F	Cl	Br	OCH ₃
4900	F	F	Cl	Br	Br
4901	F	F	Cl	F	H
4902	F	F	Cl	F	CH ₃
4903	F	F	Cl	F	OCH ₃
4904	F	F	Cl	F	Br
4905	F	F	Cl	F	F
4906	F	F	Br	H	H
4907	F	F	Br	H	CH ₃
4908	F	F	Br	H	OCH ₃
4909	F	F	Br	H	Cl
4910	F	F	Br	H	Br
4911	F	F	Br	H	F
4912	F	F	Br	CH ₃	H
4913	F	F	Br	CH ₃	CH ₃
4914	F	F	Br	CH ₃	OCH ₃
4915	F	F	Br	CH ₃	Cl
4916	F	F	Br	CH ₃	F
4917	F	F	Br	OCH ₃	H
4918	F	F	Br	OCH ₃	CH ₃
4919	F	F	Br	OCH ₃	OCH ₃
4920	F	F	Br	OCH ₃	Cl
4921	F	F	Br	OCH ₃	F
4922	F	F	Br	Cl	H
4923	F	F	Br	Cl	CH ₃
4924	F	F	Br	Cl	OCH ₃
4925	F	F	Br	Cl	Cl
4926	F	F	Br	Cl	F
4927	F	F	Br	Br	H

10

20

30

40

【表2-120】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4928	F	F	Br	Br	CH ₃
4929	F	F	Br	Br	OCH ₃
4930	F	F	Br	Br	Cl
4931	F	F	Br	Br	Br
4932	F	F	Br	Br	F
4933	F	F	Br	F	H
4934	F	F	Br	F	CH ₃
4935	F	F	Br	F	OCH ₃
4936	F	F	Br	F	Cl
4937	F	F	Br	F	F
4938	F	F	F	H	H
4939	F	F	F	H	CH ₃
4940	F	F	F	H	OCH ₃
4941	F	F	F	H	Cl
4942	F	F	F	H	Br
4943	F	F	F	H	F
4944	F	F	F	CH ₃	H
4945	F	F	F	CH ₃	CH ₃
4946	F	F	F	CH ₃	OCH ₃
4947	F	F	F	CH ₃	Cl
4948	F	F	F	CH ₃	Br
4949	F	F	F	OCH ₃	H
4950	F	F	F	OCH ₃	CH ₃
4951	F	F	F	OCH ₃	OCH ₃
4952	F	F	F	OCH ₃	Cl
4953	F	F	F	OCH ₃	Br
4954	F	F	F	Cl	H
4955	F	F	F	Cl	CH ₃
4956	F	F	F	Cl	OCH ₃
4957	F	F	F	Cl	Cl
4958	F	F	F	Cl	Br
4959	F	F	F	Br	H
4960	F	F	F	Br	CH ₃
4961	F	F	F	Br	OCH ₃
4962	F	F	F	Br	Cl
4963	F	F	F	Br	Br
4964	F	F	F	F	H
4965	F	F	F	F	CH ₃
4966	F	F	F	F	OCH ₃
4967	F	F	F	F	Cl

10

20

30

40

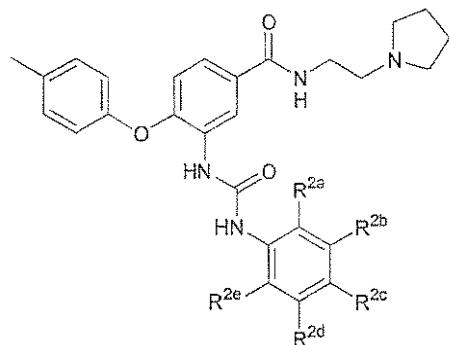
【表2-121】

化合物番号	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ^{2d}	R ^{2e}
4968	F	F	F	F	Br
4969	F	F	F	F	F

【0437】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式Vの化合物群から選択される：

【化9】



10

20

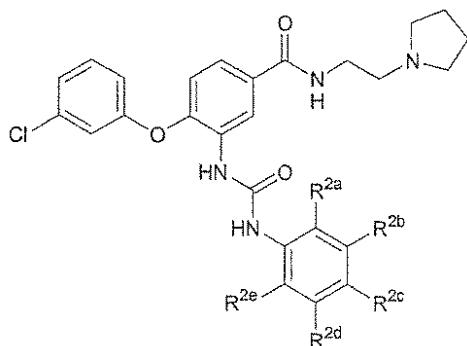
【0438】

式中、R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R^{2d}、およびR^{2e}は、表2に定義するとおりである。

【0439】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式Vの化合物群から選択される：

【化10】



30

【0440】

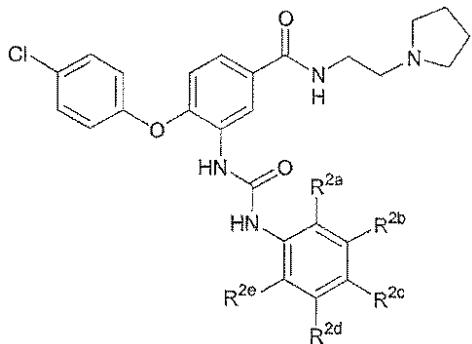
式中、R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R^{2d}、およびR^{2e}は、表2に定義するとおりである。

【0441】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式Vの化合物群から選択される：

40

【化 1 1】



10

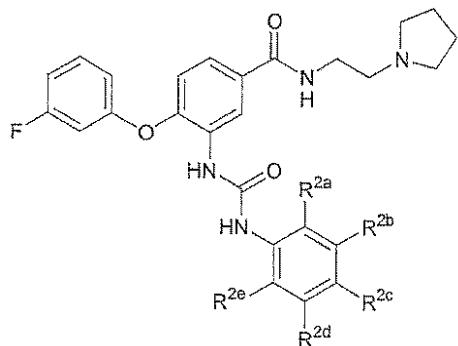
【 0 4 4 2 】

式中、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 、 R^{2d} 、および R^{2e} は、表2に定義するとおりである。

[0 4 4 3]

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式VIの化合物群から選択される：

【化 1 2】



20

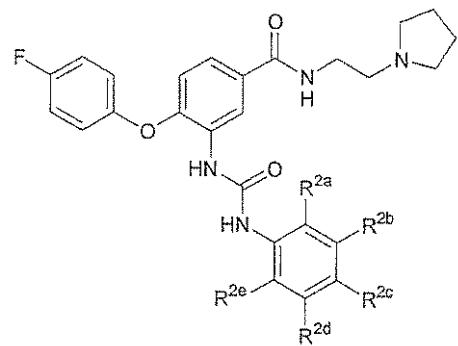
[0 4 4 4]

式中、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 、 R^{2d} 、および R^{2e} は、表2に定義するとおりである。

【 0 4 4 5 】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式Vの化合物群から選択される：

【化 1 3】



40

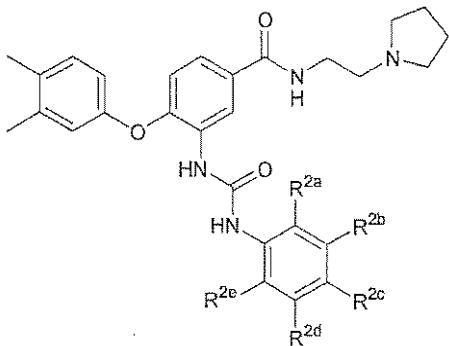
【 0 4 4 6 】

式中、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 、 R^{2d} 、および R^{2e} は、表2に定義するとおりである。

【 0 4 4 7 】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式Vの化合物群から選択される：

【化14】



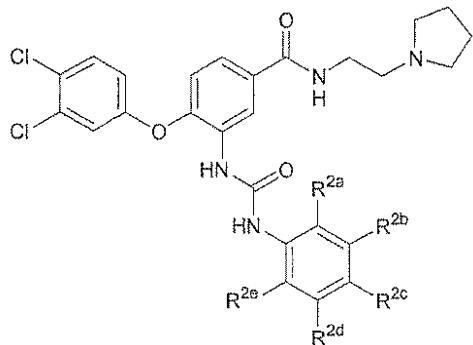
【0448】

式中、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 、 R^{2d} 、および R^{2e} は、表2に定義するとおりである。

【0449】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式Vの化合物群から選択される：

【化15】



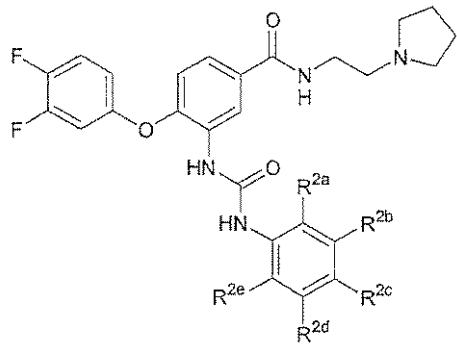
【0450】

式中、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 、 R^{2d} 、および R^{2e} は、表2に定義するとおりである。

【0451】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式Vの化合物群から選択される：

【化16】



【0452】

式中、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 、 R^{2d} 、および R^{2e} は、表2に定義するとおりである。

【0453】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式Vの化合物群から選択される：

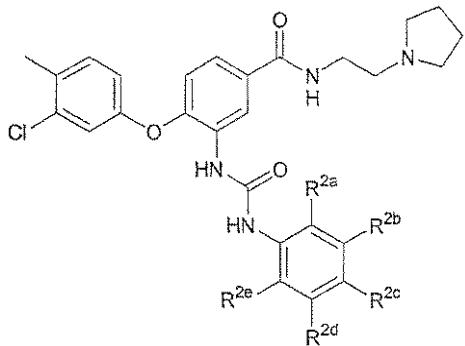
10

20

30

40

【化17】



10

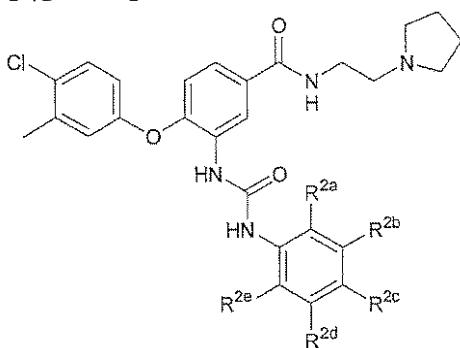
【0454】

式中、R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R^{2d}、およびR^{2e}は、表2に定義するとおりである。

【0455】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式Vの化合物群から選択される：

【化18】



20

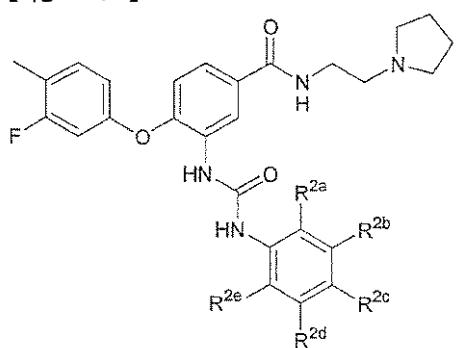
【0456】

式中、R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R^{2d}、およびR^{2e}は、表2に定義するとおりである。

【0457】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式Vの化合物群から選択される：

【化19】



40

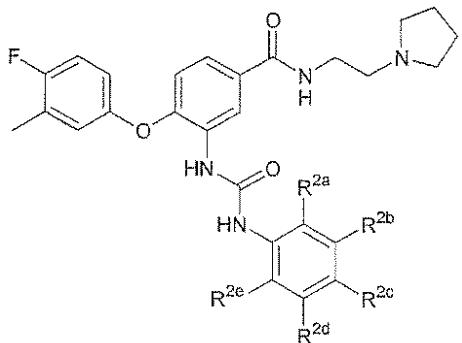
【0458】

式中、R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R^{2d}、およびR^{2e}は、表2に定義するとおりである。

【0459】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式Vの化合物群から選択される：

【化20】



10

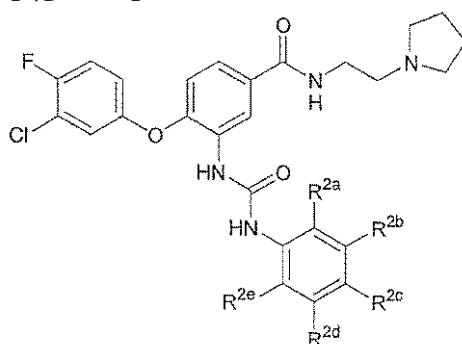
【0460】

式中、R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R^{2d}、およびR^{2e}は、表2に定義するとおりである。

【0461】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式Vの化合物群から選択される：

【化21】



20

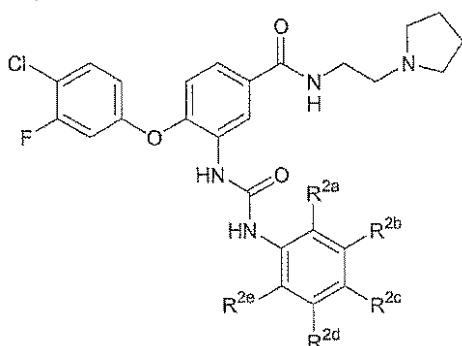
【0462】

式中、R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R^{2d}、およびR^{2e}は、表2に定義するとおりである。

【0463】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式Vの化合物群から選択される：

【化22】



30

【0464】

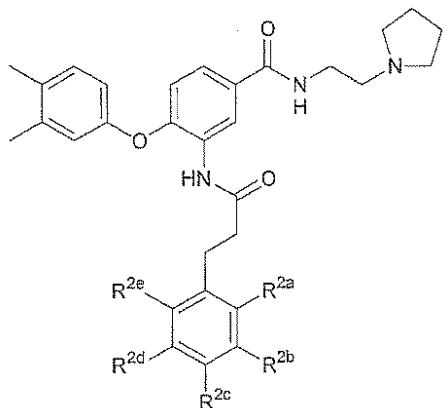
式中、R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R^{2d}、およびR^{2e}は、表2に定義するとおりである。

【0465】

もう一つの実施形態では、式Iの化合物が、以下の構造を持つ式Vの化合物群から選択される：

40

【化23】



【0466】

式中、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 、 R^{2d} 、および R^{2e} は、表2に定義するとおりである。

【0467】

式Iの化合物は、後述するリガンド結合アッセイによって証明されるとおり、MCH受容体アンタゴニストである。MCH受容体アンタゴニスト活性は、肥満および食欲亢進などの摂食障害、ならびに糖尿病の処置に関して、薬学的活性との相関が示されている。式Iの化合物は、標準的なインビトロMCHカルシウム動員アッセイおよび/または受容体結合アッセイ、特に後述するアッセイ（実施例23および24参照）において、良好な活性を示す。一般に式Iの化合物は、下記実施例23に例示するような標準的インビトロMCH受容体媒介カルシウム動員アッセイで決定した場合に、約10 μM以下、好ましくは約1 μM以下、より好ましくは約100nM以下、さらに好ましくは約10nM以下の K_i を持つ。一般に式Iの化合物は、MCH受容体アンタゴニストであり、下記実施例24に記載するような標準的インビトロMCH受容体結合アッセイで決定した場合に、約10 μM以下、好ましくは約1 μM以下、より好ましくは約100nM以下、さらに好ましくは約10nM以下の IC_{50} 値を示す。

20

【0468】

式IのMCH受容体アンタゴニストは、好ましくは、特異的に、より一層好ましくは、高い親和性で、MCH受容体に結合する。

30

【0469】

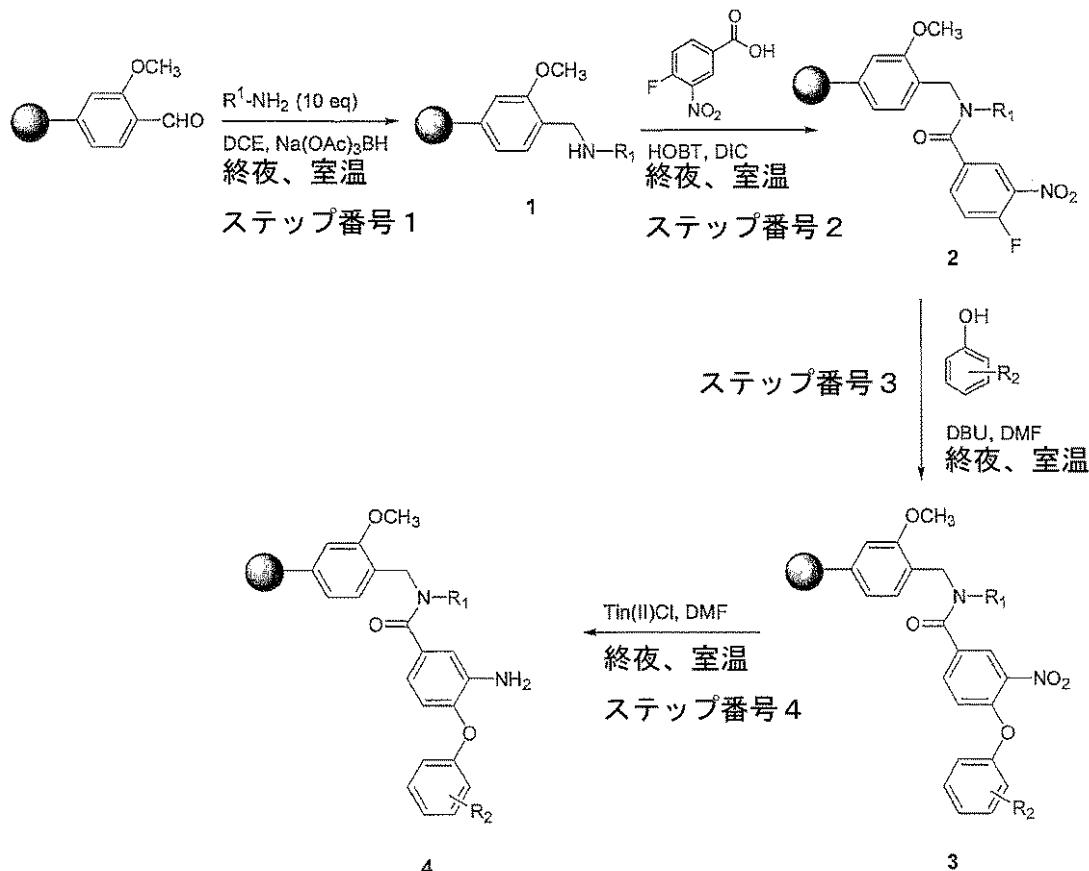
以下、実施例により、本発明を例示する。

【実施例】

【0470】

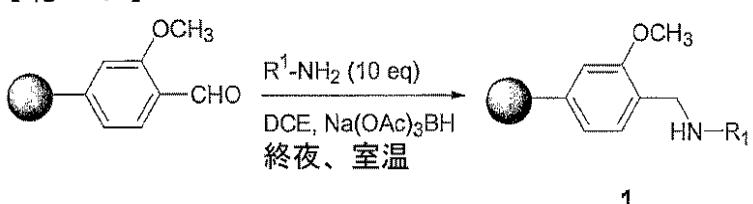
実施例1

【化 2 4】



ステップ 1

【化 2 5】

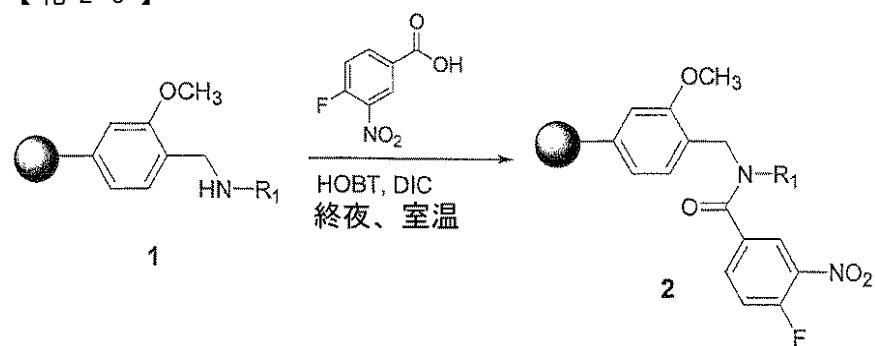


2Lガラス瓶に、4-ホルミル-3-メトキシフェノキシ-ポリスチレン樹脂（100～180メッシュ、負荷量1.1mmol/g、20g、22mmol）、アミン（5等量、110mmol）、および無水DCE（500mL）を加えた。得られた混合物を室温で1時間振とうした。次に、 $\text{Na(OAc)}_3\text{BH}$ （5等量、110mmol）を加え、その混合物を室温で終夜振とうした。最初の3時間は半時間ごとに混合物を脱気した。樹脂を濾過し、MeOH（2回）およびDCM（2回）で洗浄することにより、1を得た。

[0 4 7 1]

ステップ2

【化 2 6】

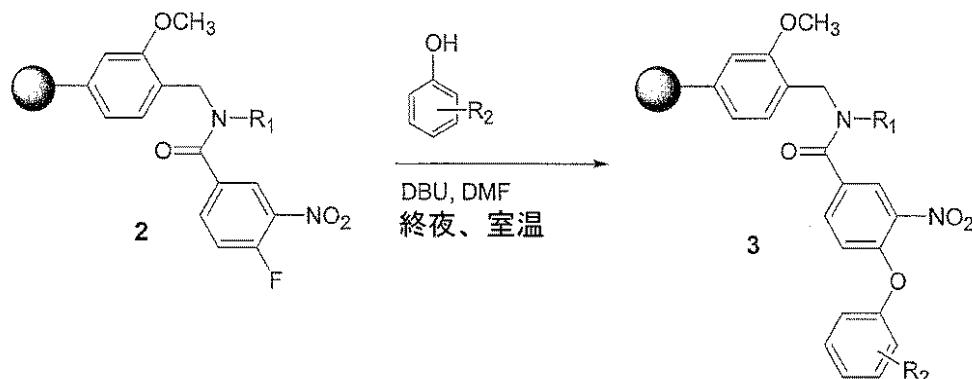


2Lガラス瓶に、1、4-フルオロ-3-ニトロ安息香酸(24.4mmol、132mmol)、HOt(18g、132mmol)、DIC(42mL、264mmol)、およびDMF(500mL)を加えた。得られた混合物を室温で終夜振とうした。樹脂を濾過し、DMF(2回)、MeOH(2回)、およびDCM(2回)で洗浄することにより、2を得た。

【0472】

ステップ3

【化27】

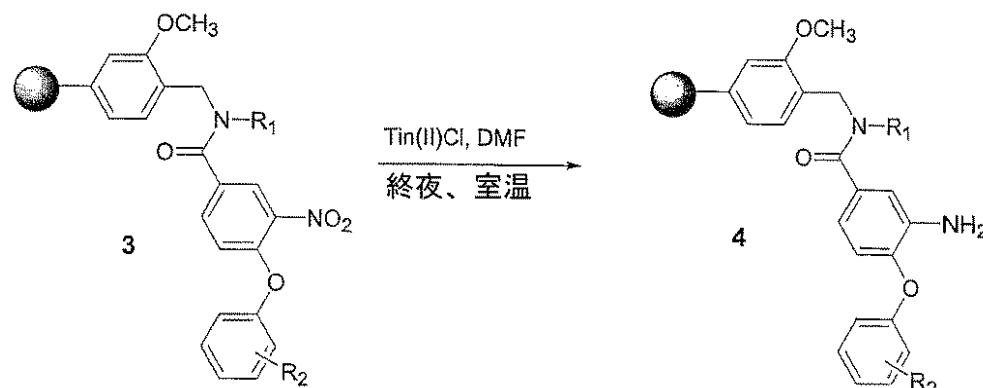


2Lガラス瓶に、2、フェノール(27g、220mmol)、DBU(20mL、132mmol)、およびDMF(400mL)を加えた。得られた混合物を室温で終夜振とうした。次に、樹脂を濾過し、DMF(2回)およびDCM(2回)で洗浄することにより、3を得た。

【0473】

ステップ4

【化28】

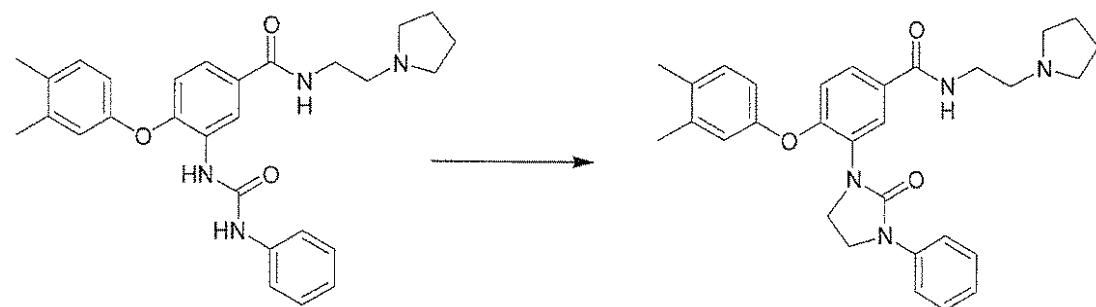


2Lガラス瓶に、3、塩化スズ(II)・2H₂O(49.5g、220mmol)およびDMF(400mL)を加えた。次に、得られた混合物を室温で終夜振とうした。樹脂を濾過し、DMF(2回)およびDCM(2回)で洗浄することにより、4を得た。

【0474】

実施例2

【化29】



方法 1

出発物質 (10mg、0.021mmol) を、0.5mLのDMF中、室温で、1,2-ジプロモエタン (2.3μL、0.025mmol) およびNaH (1mg、0.042mmol) と混合した。次に、その混合物を80℃に1時間加熱した。反応混合物を水およびEtOAcで後処理した。

【0475】

方法 2

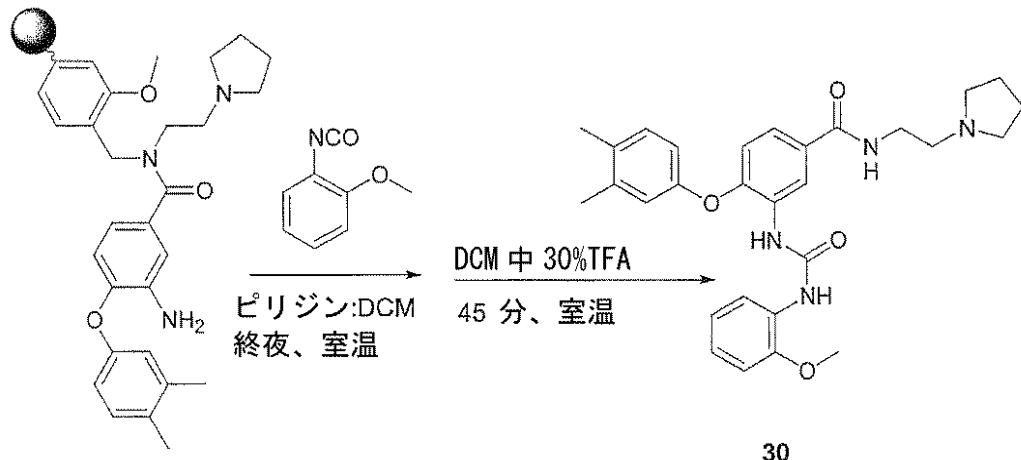
出発物質 (20mg、0.04mmol) を、0.5mLのDMF中で、1,2-ジヨードエタン (14.3mg、0.05mmol) およびNaH (2mg、0.08mmol) と混合した後、上述のように反応させた。

【0476】

実施例 3

10

【化30】



ペプチド容器に樹脂（負荷量1.1mmol/g、100mg、0.11mmol）、イソシアヌ酸2-メトキシフェニル (1.1mmol)、およびピリジン：DCM (5mL、比1:1) を加えた。得られた混合物を室温で終夜振とうした。樹脂をDCMで洗浄(2回)した。次に、DCM中の30%TFA (10mL) を加え、得られた混合物を室温で45分間振とうした。樹脂を濾過し、DCMで洗浄(2回)した。濾液を濃縮することにより、30を得た。

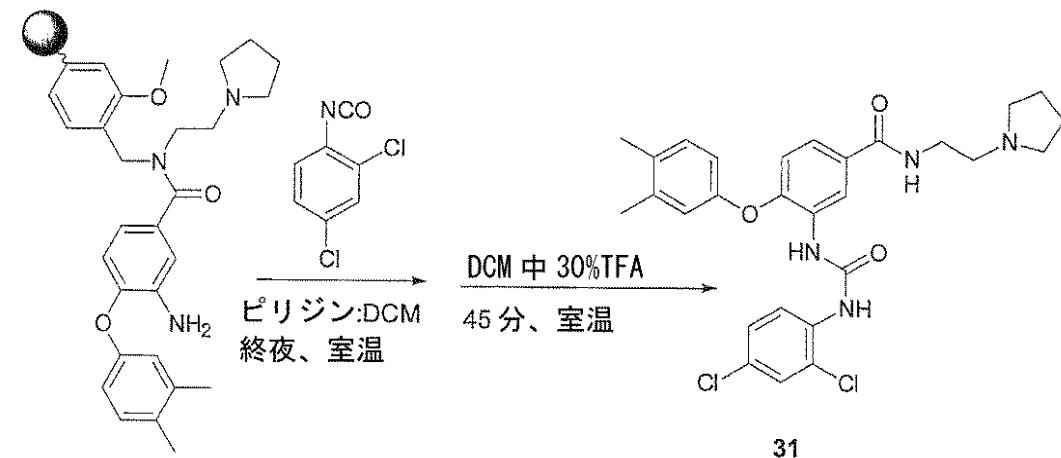
【0477】

30

実施例4～16を、実施例3に示した手順に従って製造した。

実施例 4

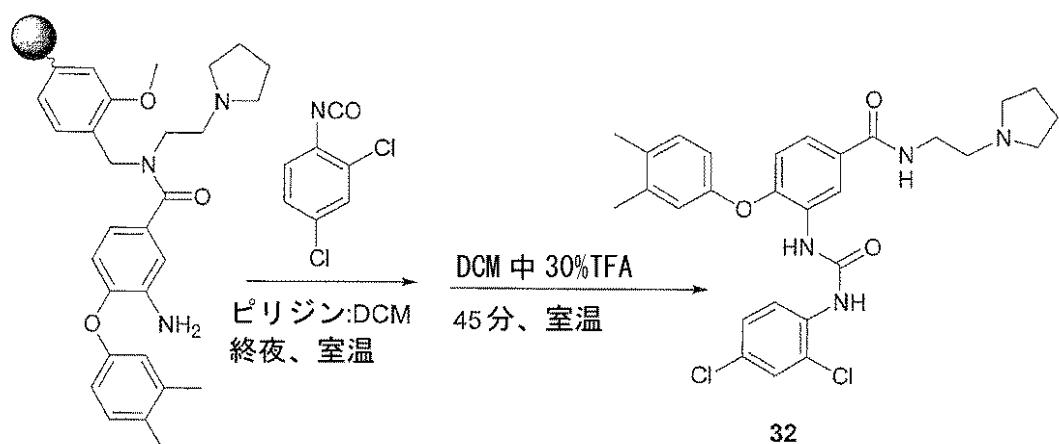
【化31】



実施例 5

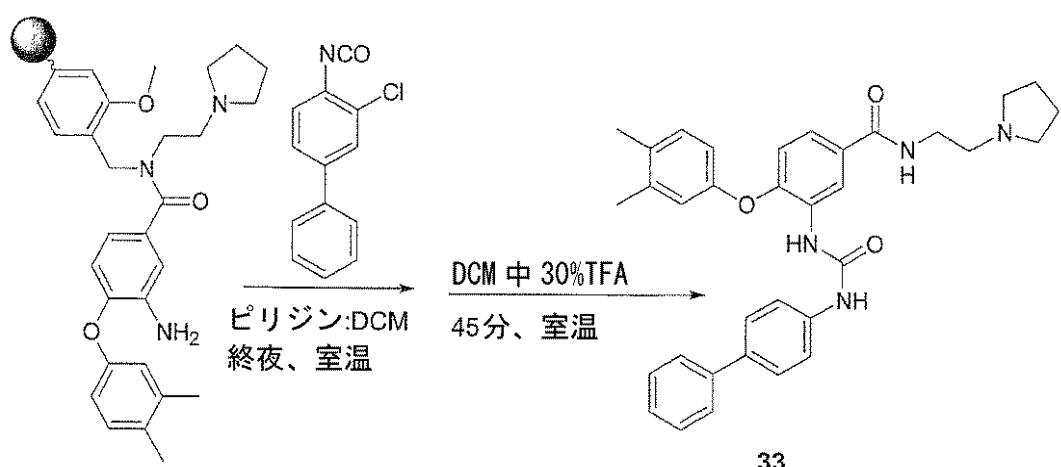
40

【化32】



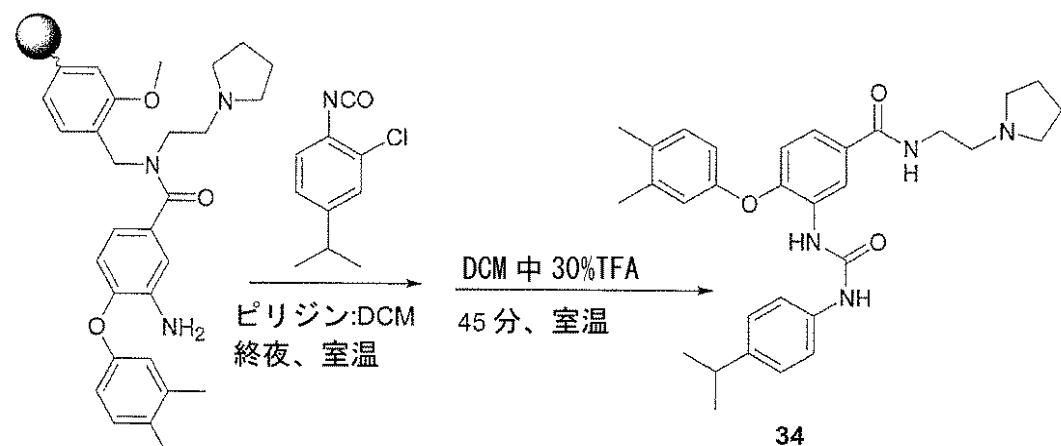
実施例 6

【化33】



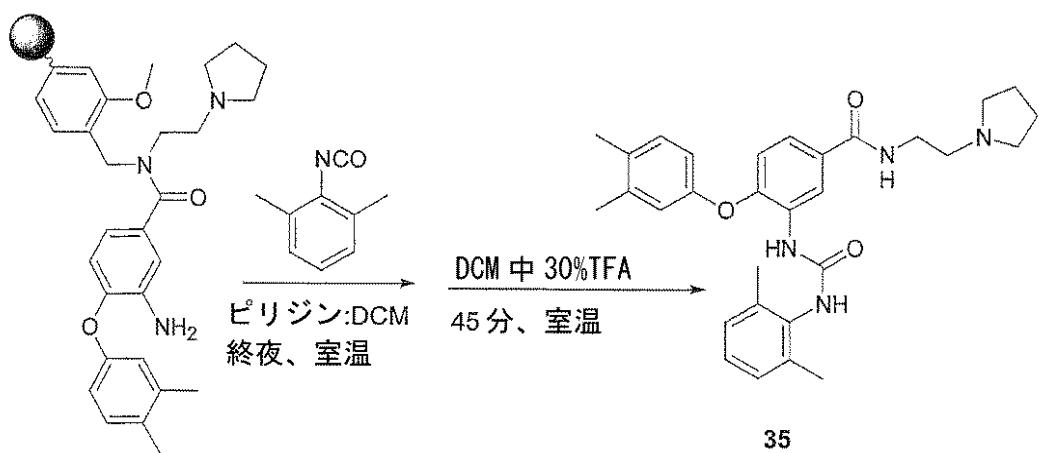
実施例 7

【化34】



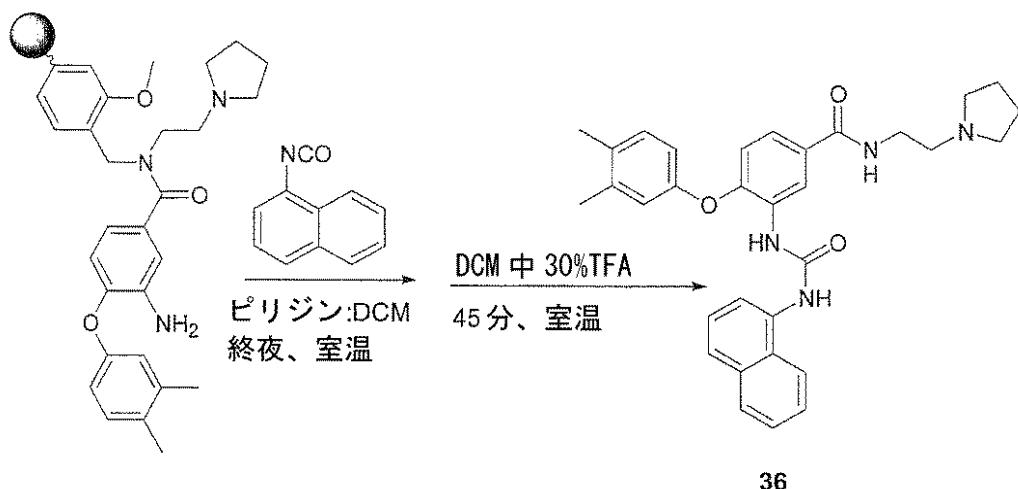
実施例 8

【化35】



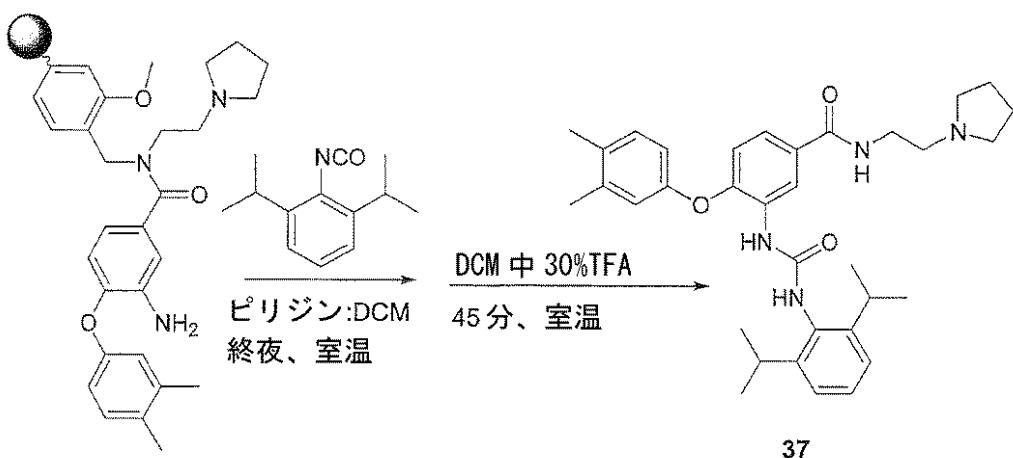
実施例 9

【化36】



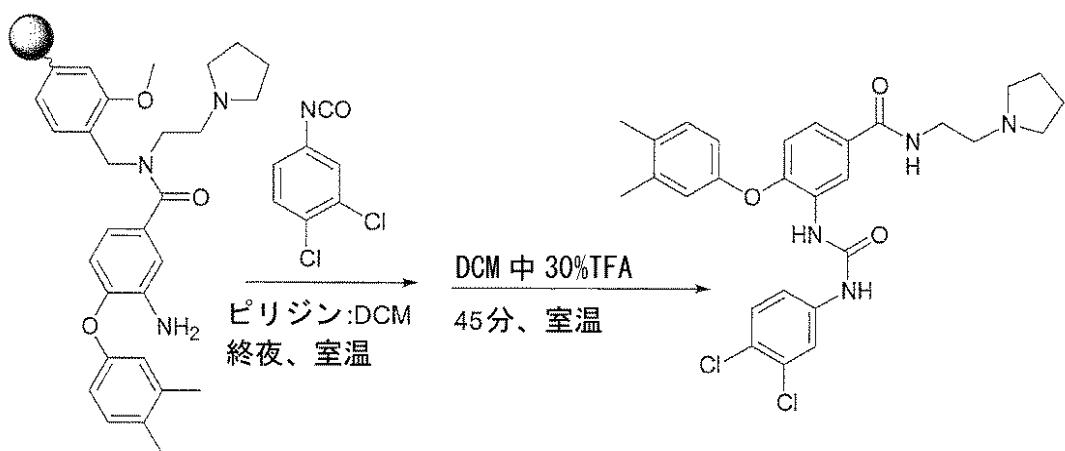
実施例 10

【化37】



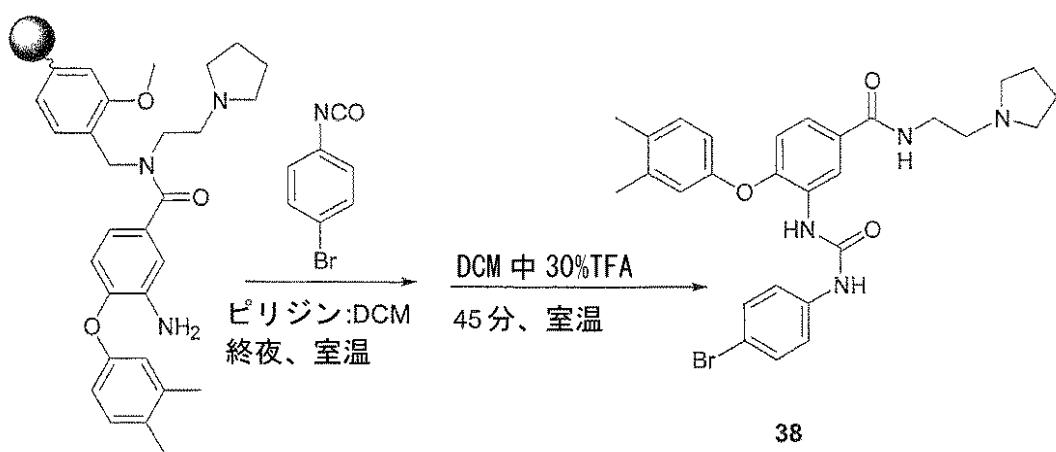
実施例 11

【化 3 8】



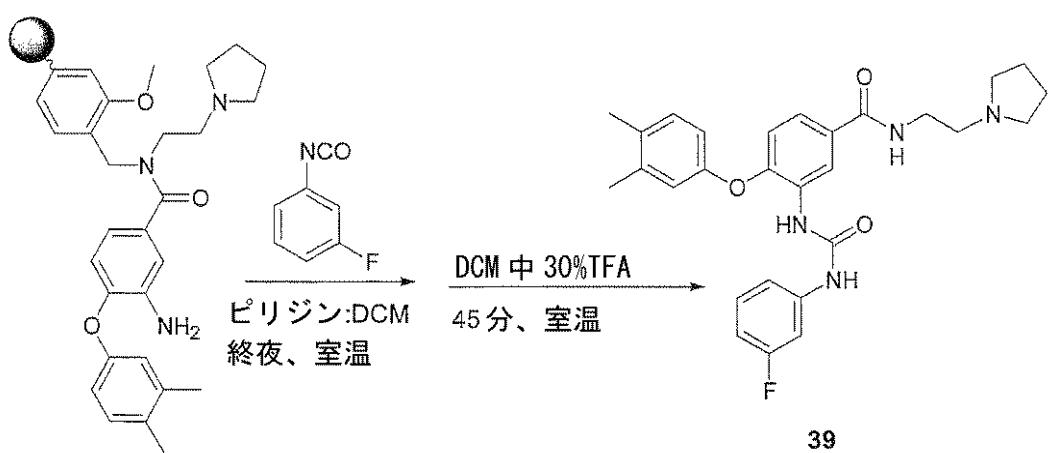
実施例 1 2

【化 3 9】



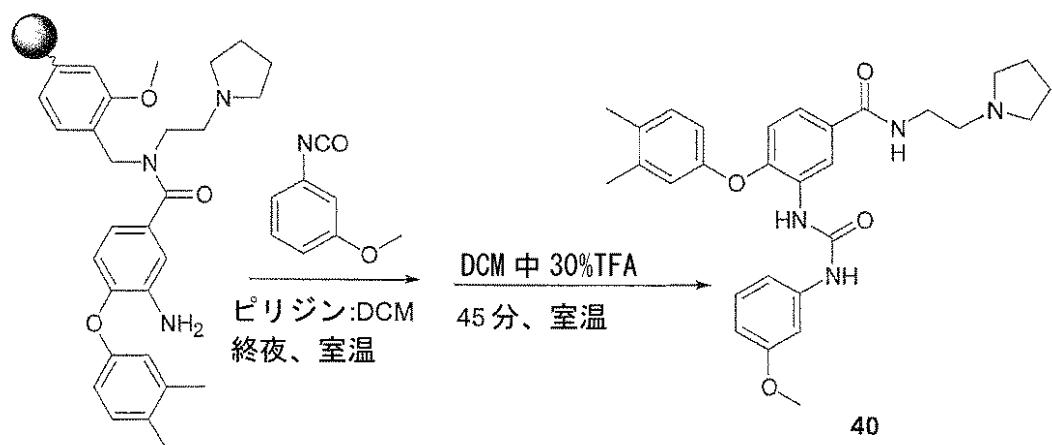
実施例 1 3

【化 4 0】



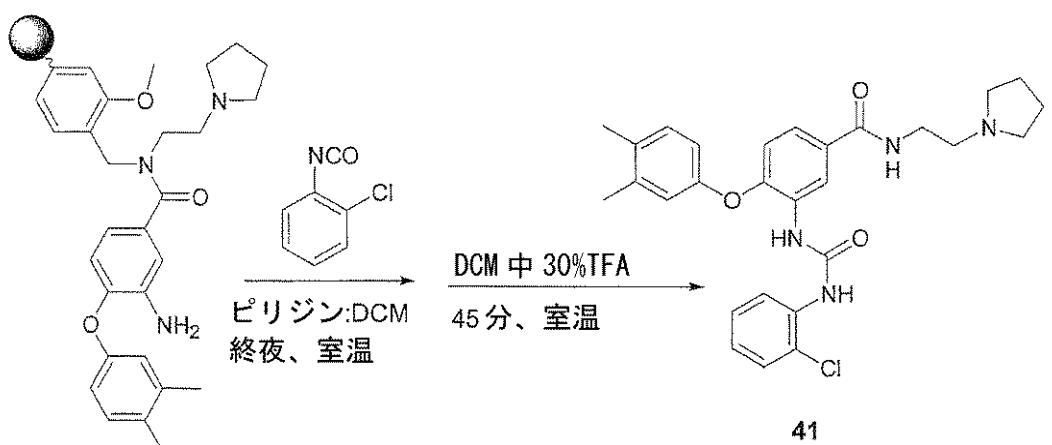
実施例 1 4

【化41】



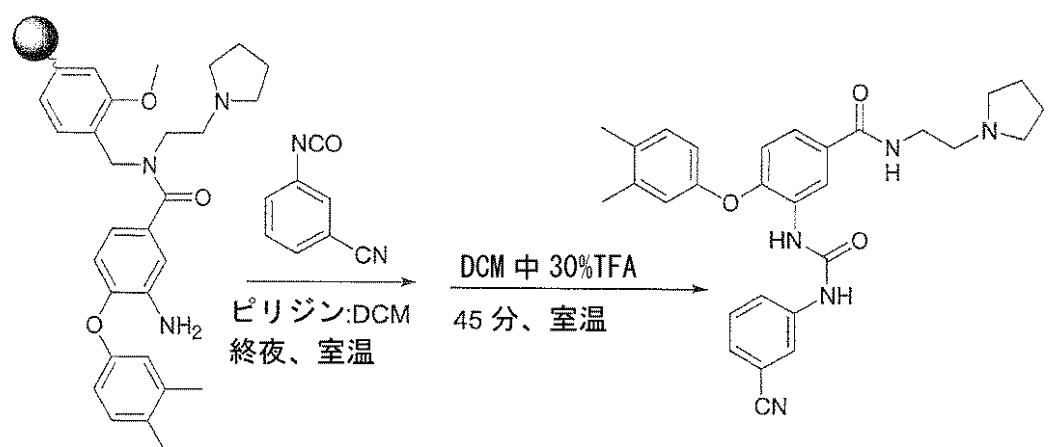
実施例15

【化42】



実施例16

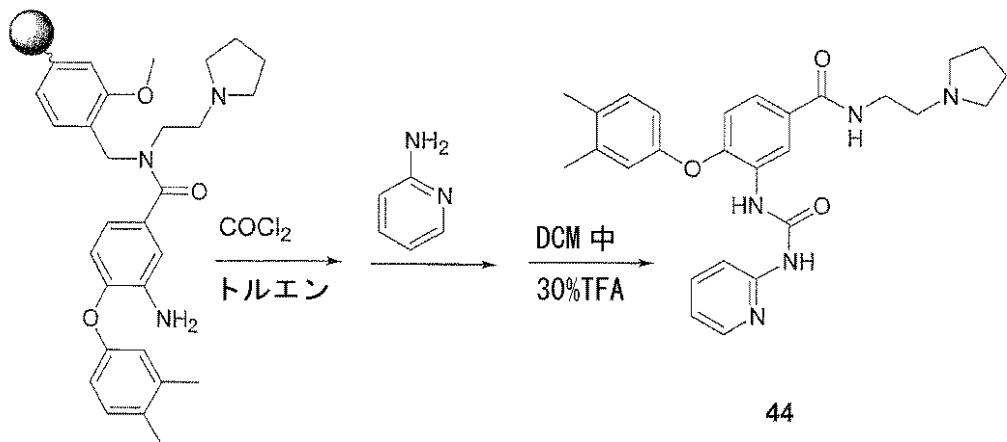
【化43】



【0478】

実施例17

【化44】

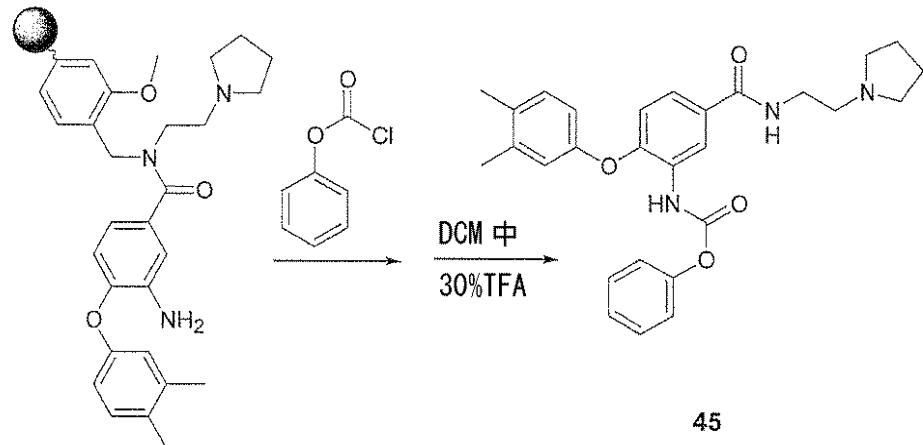


丸底フラスコに、樹脂（500mg、0.55mmol）およびDCM（15mL）を加えた。得られた混合物を-78℃に冷却した。次に、トルエン中の20%ホスゲン（540mg）を滴下した。得られた混合物を室温に温め、3時間振とうした。樹脂を濾過し、DCMで洗浄（2回）した。樹脂をペプチド容器に移し、過剰量（10~15等量）のアミノピリジンを15mLのDCMと共に加えた。得られた混合物を室温で終夜振とうした。樹脂をDCMで洗浄（2回）した。次に、DCM中の30%TFA（50mL）を加え、得られた混合物を45分間振とうした。樹脂を濾過し、DCMで洗浄（2回）した。濾液を濃縮することにより、44を得た。

【0479】

実施例18

【化45】



ペプチド容器に、樹脂（1.1mmol/g、200mg、0.22mmol）、クロロギ酸フェニル（143μL、1.1mmol）、およびDCM：ピリジン（7mL、比1:1）を加えた。得られた混合物を室温で終夜振とうした。樹脂をDCMで洗浄（2回）した。DCM中の30%TFA（50mL）を加え、得られた混合物を室温で45分間振とうした。樹脂を濾過し、DCMで洗浄（2回）した。濾液を濃縮することにより、45を得た。

【0480】

実施例19

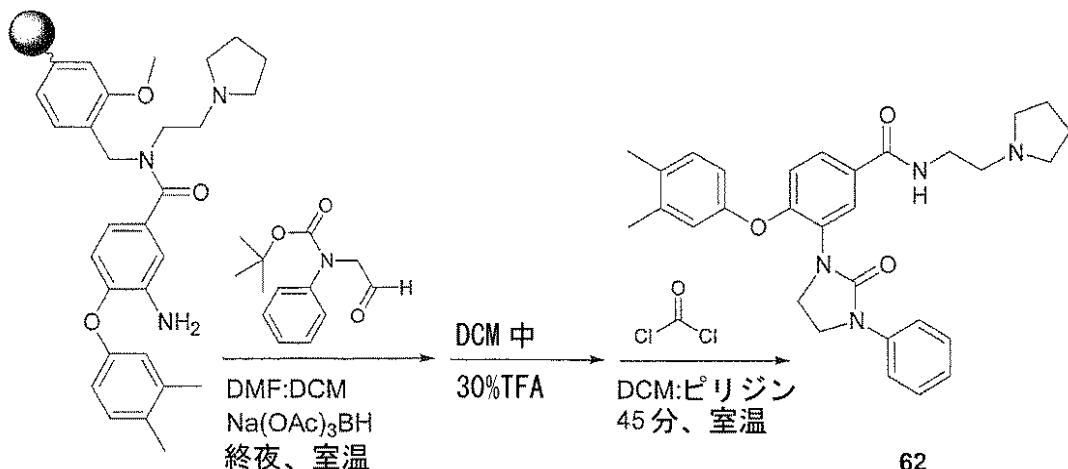
10

20

30

40

【化46】



ペプチド容器に、樹脂(1.1mmol/g、1.1g、1.21mmol)、2-オキソエチル(フェニル)カルバミン酸1,1-ジメチルエチル(490mg、3.63mmol)、およびDCM:DMF(10mL、比1:1)を加えた。その混合物を室温で30分間振とうした。次に、 $\text{Na(OAc)}_3\text{BH}$ (1.27g、6.05mmol)を加え、その混合物を室温で終夜振とうした。最初の3時間は半時間ごとに混合物を脱気した。樹脂をMeOH(2回)およびDCM(2回)で洗浄した。次に、DCM中の30%TFA(50mL)を加え、得られた混合物を室温で45分間振とうした。樹脂を濾過し、DCM(2回)で洗浄した。濾液を濃縮し、乾燥した。次に、ホスゲン(27.1 μL 、0.274mmol)およびDCM:ピリジン(5mL、比1:1)を粗製混合物に加えた。得られた混合物を室温で45分間攪拌した。混合物を濃縮し、カラムクロマトグラフィーで精製することにより、**62**を得た。

20

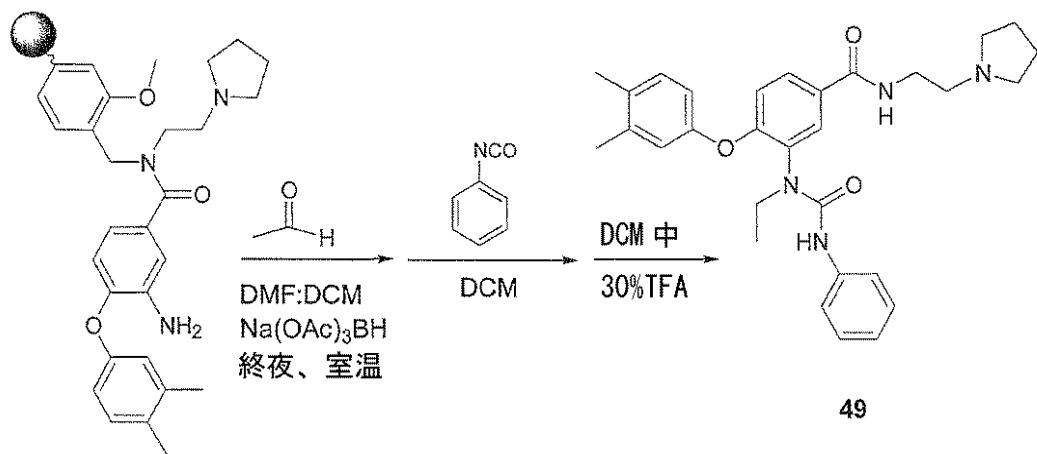
20

30

【0481】

実施例20

【化47】



ペプチド容器に、樹脂(1.1mmol/g、500mg、0.55mmol)、アセトアルデヒド(93 μL 、1.65mmol)、およびDCM:DMF(8mL、比1:1)を加えた。その混合物を室温で30分間振とうした。次に、 $\text{Na(OAc)}_3\text{BH}$ (580mg、2.75mmol)を加え、その混合物を室温で終夜振とうした。最初の3時間は半時間ごとに混合物を脱気した。樹脂をMeOH(2回)およびDCM(2回)で洗浄した。次に、イソシナトベンゼン(327 μL 、2.75mmol)およびDCM(10mL)をペプチド容器中の樹脂に加えた。得られた混合物を室温で終夜振とうした。樹脂をDCMで洗浄(2回)した。次に、DCM中の30%TFA(50mL)を加え、得られた混合物を室温で45分間振とうした。樹脂を濾過し、DCMで洗浄(2回)した。濾液を濃縮することにより、**49**を得た。

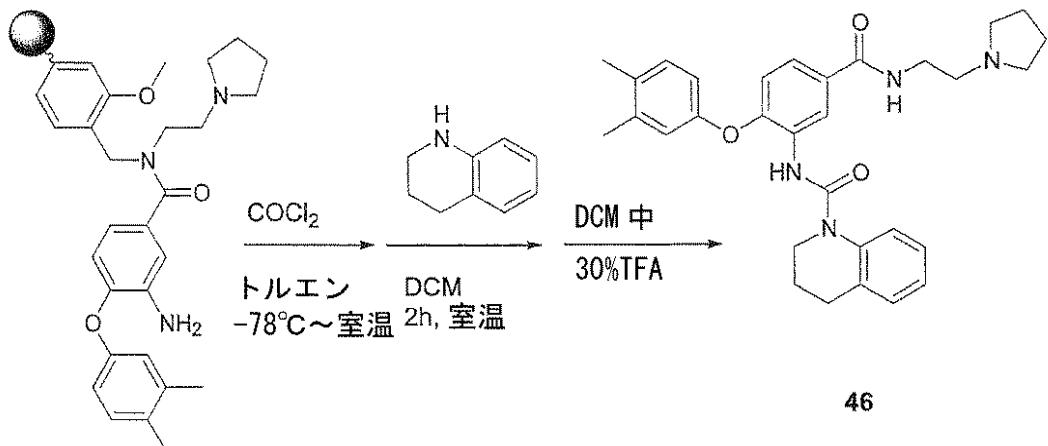
40

【0482】

実施例21

50

【化48】



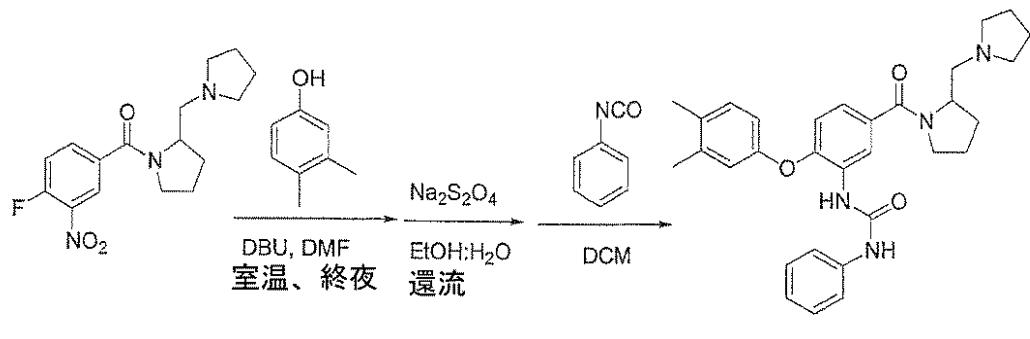
丸底フラスコに、樹脂 (1.1mmol/g、400mg、0.44mmol) およびDCM (7mL) を加えた。得られた混合物を-78℃で攪拌し、ホスゲン (217mg、2.2mmol) を滴下した。その混合物を室温まで温め、3時間振とうした。樹脂をDCMで洗浄(2回)し、ペプチド容器に移した。次に、1,2,3,4-テトラヒドロキノリン (585μL、4.4mmol) を容器に加えた。得られた混合物を2時間振とうした。樹脂をDCMで洗浄(2回)した。次に、DCM中の30%TFA (30mL) を加え、得られた混合物を室温で45分間振とうした。樹脂を濾過し、DCMで洗浄(2回)した。濾液を濃縮することにより、46を得た。

20

【0483】

実施例22

【化49】



20mLバイアルに、1-((4-フルオロ-3-ニトロフェニル)カルボニル)-2-(1-ピロリジニルメチル)ピロリジン (520mg、1.62mmol)、3,4-ジメチルフェノール (237mg、1.94mmol)、DBU (271μL、1.78mmol)、およびDMF (10mL) を加えた。得られた混合物を室温で終夜攪拌した。その混合物をH₂OおよびEtOAcで抽出した。有機層を合わせ、MgSO₄で乾燥し、濃縮することにより、粗製中間体を得た。その中間体をカラムクロマトグラフィーで精製することにより、純粋な中間体を得た。次に、その中間体にEtOH:H₂O (3:1) およびNa₂S₂O₄ (10等量) を加えた。得られた混合物を終夜還流した。次に、その混合物を室温まで冷却し、H₂OとEtOAcで抽出した。有機層を合わせ、MgSO₄で乾燥し、濃縮することにより、粗製中間体を得た。その粗製中間体をカラムクロマトグラフィーで精製することにより、純粋な中間体を得た。その精製中間体を丸底フラスコに入れ、DCMおよびイソシアニ酸フェニル (1等量) を加えた。得られた混合物を室温で1時間攪拌した。溶媒を除去し、粗製の所期生成物をカラムクロマトグラフィーで精製することにより、63を得た。

40

【0484】

実施例23

機能アッセイ

ヒト、ラット、またはマウスMCH受容体を発現させるヒト胎児腎臓細胞（293全細胞）を150mm培養皿からPBSを使って収集した。1500rpmで2分間の遠心分離により、まず細胞をペレット化した。次に、得られたペレットを、15mLの氷冷ショ糖緩衝液（25mM HEPES、0.3Mショ糖、pH7.4）中、動力付きガラス外筒テフロン（登録商標）ホモジナイザーでホモジナイズした。ホモジネートを48,000×g、4°で10分間遠心分離し、Tissue-Tearor（登録商標）（Biospec Products）を使って15mLのアッセイ緩衝液（25mM HEPES、10mM MgCl₂、0.2% BSA、0.1mg/mL STI、0.1mg/mLペファブロック（Pefabloc（登録商標））、1μMホスホラミドン、pH7.4）に再懸濁し、再び48,000×gで10分間遠心分離した。15mLのアッセイ緩衝液中で、Tissue-Tearor（登録商標）を使ってペレットを三たびホモジナイズし、再び48,000×gで10分間遠心分離した。得られたペレットを10～20mg/mLの湿重量濃度でアッセイ緩衝液に再懸濁した。
10

【0485】

薬理学的解析は、[Ca⁺⁺]i動員の高分解能用応答蛍光測定値を与えるHT-PS100装置（Axion Biotechnologies、カリフォルニア州サンディエゴ）を使用するか、FLIPR（登録商標）装置（Molecular Devices、カリフォルニア州サニーベール）を使用して行なった。

【0486】

HT-PS100プロトコール：

材料：HEK293細胞にラットMCH1受容体を安定にトランスフェクトし、G418抗生物質圧下で維持した。HT-PS100アッセイ緩衝液は、生理食塩水（145mM NaCl、5.4mM KCl、1.0mM Na₂PO₄、1.8mM CaCl₂、0.8mM MgSO₄、15.0mM HEPES、pH7.4、11.2mMグルコース）+50μM プルロニックF127からなった。MCHペプチド（Amgen, Inc.）をアッセイ緩衝液で復元し、全ての実験に陽性アゴニスト対照として使用した。試験化合物は100% DMSO中に10mM原液として調製し、96穴プレートで100μMの最高作業濃度に希釈した。
20

【0487】

方法：MCH1Rを安定に発現させるHEK293を、2mMグルタミンおよび10%透析ウシ胎仔血清（HyClone、ユタ州ローガン）を添加したダルベッコ変法イーグル培地（GIBCO/Life Technologies、メリーランド州ロックビル）中、37°、5% CO₂で維持した。ベルセン（Versene）（GIBCO/Life Technologies）で10分間処理してから粉碎し、冷（4°）ハイブリドーマ培地（血清/タンパク質フリー、L-グルタミン、重炭酸ナトリウム、MOPS緩衝液入り）（Sigma-Aldrich Corp、ミズーリ州セントルイス）で2回洗浄することによって細胞を収集し、同じ培地に2×10⁶細胞/mLの密度で再懸濁した。1.6μMのFura-2AM（Molecular Probes、オレゴン州ユージーン）と共に室温で60分間インキュベートすることにより、再懸濁した細胞に蛍光カルシウム指示薬Fura-2を負荷した。次に、負荷細胞をハイブリドーマ培地で2回洗浄し、2×10⁵細胞/mLに調節し、実験中は、最高6時間まで穏やかに攪拌しながらスピナーフラスコ中で周囲温度に保った。
30

【0488】

交互励起波長340/380nmおよび放射波長510nmで測定したFura-2蛍光強度比R340/380の増加を監視することにより、受容体刺激細胞内カルシウム応答を、HT-PS100のフロースルーチュベットで検出した。

【0489】

MCHペプチドに対するMCH1Rの用量応答の速度論を決定するために行なった事前の静的実験により、最大Ca⁺⁺トランジエントを捕捉するのに最適な時点は30秒であることが示された。DMSOによる干渉は1%まで見られなかった。これらの観察結果に基づいて、それ以降の実験をHT-PS100で行なうことにより、高分解能用応答曲線を作成し、アゴニスト/アンタゴニスト特性を特徴づけ、シルド実験によってアンタゴニスト効力を評価した。HT-PS100検証では、広範囲にわたる細胞継代数および収集密度で、10nMのMCHに関して再現性のあるEC₅₀が得られた。HT-PS100勾配生成はフルオレセインの標準原液を使って較正した。
40

【0490】

試験化合物を、MCH1R活性に関して、HT-PS100で、アゴニスト作用とアンタゴニスト作

用の両方についてスクリーニングした。アゴニストモードの試験は100 μ Mの最大勾配濃度で行なった。アンタゴニスト活性は、100 μ Mの化合物濃度で細胞を30秒間プレインキュベートした後、予備実験で決定したEC₅₀の5倍の濃度のMCHを導入することによって試験した。MCH誘発性Ca⁺⁺応答の阻害を示す化合物は、再調査、IC₅₀生成、およびシルド解析のために、自動的にタグ付けされた。

【0491】

選択された化合物について、細胞をアンタゴニスト化合物と共に30秒間プレインキュベートしてからMCHペプチドを投与することにより、HT-PS100でシルド実験を行なった。固定濃度のアンタゴニスト化合物を10倍刻みでいくつか調製し、増加するMCH濃度の勾配を導入する30秒前に、細胞に提示した。化合物についての値pA2を、Log(アンタゴニスト濃度)の関数としてのLog(DR-1) MCH EC₅₀の線形回帰によって計算した(式中、DRは、アンタゴニストの存在下および非存在下で決定されるMCH EC₅₀値の用量比である)。

【0492】

以下の化合物はHT-PS100アッセイで100 μ M以下のK_i値を持っていた：化合物番号 。このうち、化合物番号 は、このアッセイで100nM以下のK_i値を持っていた。

【0493】

FLIPR(登録商標)プロトコール：

材料：FLIPR(登録商標)装置(Molecular Devices、カリフォルニア州サンノーベル)を使って薬理学的解析を行なった。CHOK1-Gqi細胞にラットMCH1受容体を安定にトランスフェクトし、G418抗生物質圧下で維持した。FLIPR(登録商標)アッセイ緩衝液は、フェノールレッドフリーDMEM+2.5mMプロベネシドからなった。MCHペプチド(Amgen, Inc.)をアッセイ緩衝液で復元し、全ての実験に陽性アゴニスト対照として使用した。試験化合物は100%DMSO中に10mM原液として調製し、96穴黒色平底コラーゲンI被覆プレート(Becton Dickinson、マサチューセッツ州ベッドフォード)で10 μ Mの最高作業濃度に希釈した。

【0494】

方法：MCH1Rを安定に発現させるCHOK1-Gqi細胞を、2mMグルタミンおよび10%透析ウシ胎仔血清(HyClone、ユタ州ローガン)を添加したダルベッコ変法イーグル培地(GIBCO/Life Technologies、メリーランド州ロックビル)中、37℃、5%CO₂で維持した。ベルセン(GIBCO/Life Technologies)で10分間処理してから粉碎し、冷(4℃)ハイブリドーマ培地(血清/タンパク質フリー、L-グルタミン、重炭酸ナトリウム、MOPS緩衝液入り)(Sigma-Aldrich Corp、ミズーリ州セントルイス)で2回洗浄することによって細胞を収集し、密度が10,000細胞/ウェルになるように、96穴黒色平底コラーゲンI被覆プレートに再播種した。次に、1.6 μ Mの蛍光カルシウム指示薬Fura-2(Molecular Probes、オレゴン州ユージーン)を室温で60分間、細胞に負荷した。次に、負荷細胞を90 μ l/ウェルの洗浄緩衝液(1×HBSS、20mM HEPES、2.5mMプロベネシド)で2回洗浄した。

【0495】

Fura-2蛍光応答の増加を監視することにより、FLIPR(登録商標)を使って、受容体刺激細胞内カルシウム応答を検出した。

【0496】

試験化合物を、MCH1R活性に関して、FLIPR(登録商標)で、アゴニスト作用とアンタゴニスト作用の両方についてスクリーニングした。アゴニストモードの試験は1 μ Mの最大勾配濃度で行なった。アンタゴニスト活性は、MCHのEC₅₀の300倍と定められた化合物濃度(典型的には1 μ M)で細胞を10分間プレインキュベートした後、予備実験で決定したEC₅₀の5倍の濃度のMCHを導入することによって試験した。MCH誘発性MCH1R依存的Ca⁺⁺応答の阻害を示す化合物は、再調査、IC₅₀生成、およびシルド解析のために、自動的にタグ付けされた。

【0497】

選択された化合物について、アンタゴニスト化合物をMCHペプチドと共に同時投与することにより、FLIPR(登録商標)でシルド実験を行なった。固定濃度のアンタゴニスト化

10

20

30

40

50

合物を10倍刻みでいくつか調製し、増加するMCH濃度の勾配中の細胞に提示した。化合物についての値pA2を、アンタゴニスト濃度の関数としてのMCH EC₅₀の線形回帰によって計算した。

【0498】

以下の化合物はrMCH FLIPR(登録商標)アッセイで100μM以下のK_i値を持っていた：化合物番号1、5、6、15、22、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、41、51、53、54、55、56、57、58、59、および64。このうち、化合物番号1、6、15、31、32、38、39、40、および41は、このアッセイで100nM以下のK_i値を持っていた。

【0499】

以下の化合物は、hMCH FLIPR(登録商標)アッセイで100μM以下のK_i値を持っていた：化合物番号1、5、6、34、35、36、37、38、40、41、51、52、53、54、55、56、57、58、59、および64。このうち、化合物番号1、6、34、35、38、40、41、51、56、および57は、このアッセイで100nM以下のK_i値を持っていた。

【0500】

実施例24

リガンド結合アッセイ

結合アッセイは、HEK293で発現させたマウス、ラットまたはヒトMCH1受容体（それぞれmMCH1R、rMCH1R、およびhMCH1R）を使って、以下のように測定し、IC₅₀値を計算した。

【0501】

結合アッセイは96穴U底プレートで行なった。膜（組織100μg）をアッセイ緩衝液中、100μLの総液量で、様々なペプチドと共に、0.2nM ¹²⁵I-ネイティブ-MCH（Perkin-Elmer Life Sciences、マサチューセッツ州ボストン）の存在下に、30℃で90分間インキュベートした。1μMの非放射性ネイティブ-MCHの存在下で非特異的結合を評価した。PBS/0.5% BSA中に予浸しておいたUnfilter-96 GF/Cガラス纖維フィルタープレート（FilterMate（登録商標）196 Harvester、Packard Instrument Co.、コネティカット州メリデン）を通した迅速濾過によって反応を停止させた後、300μLの氷冷水で3回洗浄した。結合している放射能を、TopCount（登録商標）マイクロプレートシンチレーションおよびルミネセンスカウンター（Packard Instrument Co.、コネティカット州メリデン）を使って決定した。GraphPad Prism（登録商標）（GraphPad Software, Inc.、カリフォルニア州サンディエゴ）を使って、薬物濃度曲線の非線形回帰解析を行なった。

【0502】

以下の化合物はrMCHアッセイで100μM以下のIC₅₀値を持っていた：化合物番号1、10、12、13、15、16、17、18、22、27、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、51、52、53、54、55、56、57、58、59、61、63、64、65、および66。このうち、化合物番号1、31、38、39、40、41、51、52、53、54、55、56、57、58、59、61、および66は、rMCHアッセイで100nM以下のIC₅₀値を持っていた。

【0503】

以下の化合物はhMCHアッセイで100μM以下のIC₅₀値を持っていた：化合物番号1、5、6、8、10、12、13、15、16、17、18、20、22、27、30、31、32、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、58、59、64、65、および66。このうち、化合物番号1、6、31、32、33、34、36、37、38、39、40、41、58、59、および66は、hMCHアッセイで100nM以下のIC₅₀値を持っていた。

【0504】

本発明のいくつかの目的が達成されることは、上記からみてわかるだろう

【0505】

上述した実施形態および実施例の説明は、本発明、その原理、およびその実用的応用を当業者に知らしめることだけを目的としているので、当業者は、数多くの形態の本発明を、特定用途の要求に最も適しうるように適合させ、応用することができる。したがって、本発明は上記の実施形態に限定されるわけではなく、様々な変更を加えることができる。

【0506】

10

20

30

40

50

上記の説明および/または本願特許請求の範囲における「含む」「包含する」「持つ」(comprise、comprises、comprising、including、having)という単語の使用に関して、文脈上別段の解釈を要する場合を除き、これらの単語は、それらが排他的(exclusively)ではなく包含的(inclusively)に解釈されるべきであり、上記の説明および/または本願特許請求の範囲を解釈する際に、これらの単語のそれぞれがそのように解釈されるべきであるという前提および明確な理解の下に使用されることに留意すべきである。本発明またはその好ましい実施形態の要素を挙げる場合、「ある」「その」「前記」という用語(a、an、the、saidという冠詞)は、その要素が1つ以上存在することを意味するものとする。

【0507】

本発明のいくつかの目的が達成され、他の有利な結果が得られることは、上記からみてわかるだろう。

【0508】

上記の化合物および方法には、本発明の範囲から逸脱することなく、様々な変更を加えることができるだろうから、上記の説明に含まれる全ての事項は、例示であると解釈しなければならず、限定的な意味に解釈してはならないものとする。

【0509】

本明細書で言及した全ての米国特許および他の参考文献の全ての原文は、参照により本願に組み込まれる。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International application No. PCT/US04/25970									
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC(7) : C07D 207/06; A61K 31/40 US CL : 548/567; 514/428 <i>According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC</i>											
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) U.S. : 548/567; 514/428											
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) CAPLUS on STN											
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT <table border="1" style="width: 100%; border-collapse: collapse;"> <thead> <tr> <th style="text-align: left;">Category *</th> <th style="text-align: left;">Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages</th> <th style="text-align: left;">Relevant to claim No.</th> </tr> </thead> <tbody> <tr> <td style="vertical-align: top;">A</td> <td>EDWARDS, P.D. Discovery and Biological Activity of Orally Active Peptidyl Trifluoromethyl Ketone Inhibitors of Human Neutrophil Elastase Journal of Medicinal Chemistry (1997), Vol. 40, No. 12, pages 1876-1885 (especially Tables 1, 2, and 3).</td> <td style="text-align: center;">1-32</td> </tr> <tr> <td style="vertical-align: top;">A</td> <td>EP 0 127 124 (USV PHARMACEUTICAL CORPORATION) 05 December 1984 (05.12.1984), page 1, line 5.</td> <td style="text-align: center;">1-32</td> </tr> </tbody> </table>			Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.	A	EDWARDS, P.D. Discovery and Biological Activity of Orally Active Peptidyl Trifluoromethyl Ketone Inhibitors of Human Neutrophil Elastase Journal of Medicinal Chemistry (1997), Vol. 40, No. 12, pages 1876-1885 (especially Tables 1, 2, and 3).	1-32	A	EP 0 127 124 (USV PHARMACEUTICAL CORPORATION) 05 December 1984 (05.12.1984), page 1, line 5.	1-32
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.									
A	EDWARDS, P.D. Discovery and Biological Activity of Orally Active Peptidyl Trifluoromethyl Ketone Inhibitors of Human Neutrophil Elastase Journal of Medicinal Chemistry (1997), Vol. 40, No. 12, pages 1876-1885 (especially Tables 1, 2, and 3).	1-32									
A	EP 0 127 124 (USV PHARMACEUTICAL CORPORATION) 05 December 1984 (05.12.1984), page 1, line 5.	1-32									
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C.		<input type="checkbox"/> See patent family annex.									
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed											
Date of the actual completion of the international search 09 January 2005 (09.01.2005)	Date of mailing of the international search report 03 MAR 2005										
Name and mailing address of the ISA/US Mail Stop PCT, Attn: ISA/US Commissioner for Patents P.O. Box 1450 Alexandria, Virginia 22313-1450 Facsimile No. (703) 305-3230	Authorized officer <i>Jonah Slobodnick</i> Brian J. Davis Telephone No. 571-272-2717										

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (January 2004)

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I	テーマコード(参考)
A 6 1 K 31/40 (2006.01)	A 6 1 K 31/40	
A 6 1 K 31/4178 (2006.01)	A 6 1 K 31/4178	
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)	A 6 1 K 31/4439	
A 6 1 K 31/47 (2006.01)	A 6 1 K 31/47	
A 6 1 K 31/4025 (2006.01)	A 6 1 K 31/4025	
A 6 1 P 25/00 (2006.01)	A 6 1 P 25/00	
A 6 1 P 15/10 (2006.01)	A 6 1 P 15/10	
A 6 1 P 15/00 (2006.01)	A 6 1 P 15/00	
A 6 1 P 25/24 (2006.01)	A 6 1 P 25/24	
A 6 1 P 25/22 (2006.01)	A 6 1 P 25/22	
A 6 1 P 25/08 (2006.01)	A 6 1 P 25/08	
A 6 1 P 9/12 (2006.01)	A 6 1 P 9/12	
A 6 1 P 9/00 (2006.01)	A 6 1 P 9/00	
A 6 1 P 9/04 (2006.01)	A 6 1 P 9/04	
A 6 1 P 25/20 (2006.01)	A 6 1 P 25/20	
A 6 1 P 3/04 (2006.01)	A 6 1 P 3/04	

(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,IT,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,M,A,MD,MG,MK,MN,MW,MX,MZ,NA,NI,NO,NZ,OM,PG,PH,PL,PT,RO,RU,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SY,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,YU,ZA,ZM,ZW

(72)発明者 ポール・テンペスト

アメリカ合衆国 カリフォルニア 91320-1799, サウザンド オークス, ワン アムジエン センター ドライブ

(72)発明者 クリストファー・ハルム

アメリカ合衆国 カリフォルニア 91320-1799, サウザンド オークス, ワン アムジエン センター ドライブ

(72)発明者 ヴ・マ

アメリカ合衆国 カリフォルニア 91320-1799, サウザンド オークス, ワン アムジエン センター ドライブ

Fターム(参考) 4C055 AA01 BA02 BA53 BB17 CA01 DA01

4C069 AA06 BB02 BB34

4C086 AA01 AA02 AA03 BC07 BC17 BC28 BC38 GA07 GA08 GA16
MA01 MA04 NA14 NA15 ZA01 ZA05 ZA06 ZA12 ZA36 ZA42
ZA70 ZA81