

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2012 年 6 月 7 日(07.06.2012)



(10) 国際公開番号
WO 2012/074067 A1

- (51) 国際特許分類:
C07D 231/20 (2006.01) *A61P 35/02* (2006.01)
A61K 31/415 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2011/077829
- (22) 国際出願日: 2011 年 12 月 1 日(01.12.2011)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願 2010-268758 2010 年 12 月 1 日(01.12.2010) JP
特願 2011-217818 2011 年 9 月 30 日(30.09.2011) JP
- (71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 日産化学工業株式会社(NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) [JP/JP]; 〒1010054 東京都千代田区神田錦町 3 丁目 7 番地 1 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 西野 泰斗(NISHINO, Taito) [JP/JP]; 〒1010054 東京都千代田区神田錦町 3 丁目 7 番地 1 日産化学工業株式会社内 Tokyo (JP). 宮地 克明(MIYAJI, Katsuki) [JP/JP]; 〒1010054 東京都千代田区神田錦町 3 丁目 7 番地 1 日産化学工業株式会社内 Tokyo (JP). 岩本 俊介(IWAMOTO, Shunsuke) [JP/JP]; 〒

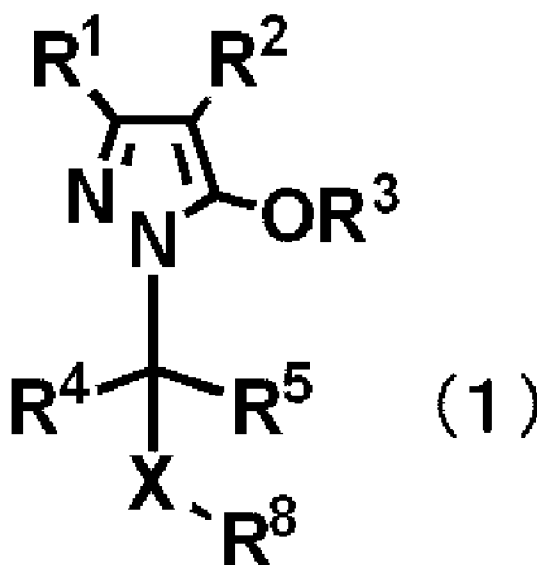
2748507 千葉県船橋市坪井西二丁目 1 〇 番 1 号 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). ミケ島 巧(MIKASHIMA, Takumi) [JP/JP]; 〒2748507 千葉県船橋市坪井西二丁目 1 〇 番 1 号 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 猿橋 康一郎(SARUHASHI, Koichiro) [JP/JP]; 〒2748507 千葉県船橋市坪井西二丁目 1 〇 番 1 号 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 岸川 遥(KISHIKAWA, Yo) [JP/JP]; 〒2748507 千葉県船橋市坪井西二丁目 1 〇 番 1 号 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP).

- (74) 代理人: 泉名 謙治, 外(SENMYO, Kenji et al.); 〒1010035 東京都千代田区神田紺屋町 1 7 番地 S I A 神田スクエア 4 階 Tokyo (JP).
- (81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST,

[続葉有]

(54) Title: PYRAZOLE COMPOUND HAVING THERAPEUTIC EFFECT ON MULTIPLE MYELOMA

(54) 発明の名称: 多発性骨髄腫の治療効果を有するピラゾール化合物



(57) Abstract: Provided is a novel therapeutic agent for myeloma. A pyrazole compound represented by general formula (1) (In the formula: R¹ represents a C1-6 alkyl, an R¹⁷-substituted C1-6 alkyl, a C1-6 haloalkyl, a phenyl, or a phenyl substituted by a number (a) of R¹¹, or the like; R² represents a hydrogen atom, a C1-6 alkyl, a phenyl, or a phenyl optionally substituted by a number (e) of R²¹, or the like; R³ represents a hydrogen atom or the like; x represents a single bond or -(CR⁶R⁷)_n-; R⁴ and R⁵ each independently represent a C1-6 alkyl or the like; R⁶ and R⁷ represent a hydrogen atom or a C1-6 alkyl; and R⁸ represents a phenyl, or a phenyl optionally substituted by a number (k) of R⁸¹, or the like.), a tautomer of the compound, or a pharmaceutically acceptable salt thereof, or a solvate thereof, and a therapeutic agent for multiple myeloma containing the aforementioned as an active ingredient.

(57) 要約: 新規な骨髄腫の治療剤を提供する。一般式(1): [式中、R¹は、C₁~C₆アルキル、R¹⁷で置換されたC₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、フェニル又はa個のR¹¹によって置換されたフェニル等を表し、R²は、水素原子、C₁~C₆アルキル、フェニル又はe個のR²¹で任意に置換されたフェニル等を表し、R³は、水素原子等を表し、Xは、単結合又は-(CR⁶R⁷)_n-を表し、R⁴及びR⁵は、各々独立してC₁~C₆ア

ルキル等を表し、R⁶及びR⁷は、水素原子又はC₁~C₆アルキルを表し、R⁸は、フェニル又はk個のR⁸¹で任意に置換されたフェニル等を表す。]で表されるピラゾール化合物、該化合物の互変異性体若しくはその医薬的に許容され得る塩又はそれらの溶媒和物、及びそれらを有効成分として含有する多発性骨髄腫の治療剤。

WO 2012/074067 A1



SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,
VC, VN, ZA, ZM, ZW.

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

ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

明 細 書

発明の名称：多発性骨髄腫の治療効果を有するピラゾール化合物
技術分野

[0001] 本発明は、多発性骨髄腫細胞の増殖阻害活性を有するピラゾール化合物、及び当該化合物を用いることを特徴とする骨髄腫の治療剤に関する。

背景技術

[0002] 多発性骨髄腫 (Multiple Myeloma) は、骨髄内の免疫細胞である形質細胞が遺伝子異常などにより悪性化した腫瘍である。これらの悪性形質細胞 (以下、骨髄腫細胞) は、血流を通過して移動すると共に骨髄に蓄積して増殖し、骨の損傷、高カルシウム血症、腎不全、貧血、神経障害及び感染症などを引き起こす。骨の損傷は、骨髄腫細胞の急激な増殖、及び骨髄腫細胞から放出されるインターロイキン-6 (IL-6) による破骨細胞の活性化に伴う骨の吸収・破壊によって引き起こされる。骨の損傷はまた、高カルシウム血症と呼ばれる病態である、血流中のカルシウムのレベルを上昇させることも誘導する。高カルシウム血症は、腎臓に傷害を与え、カルシウム排泄の減少、尿産生の増加、及び脱水の可能性をもたらす。骨髄腫細胞は骨髄内の正常細胞を締め出すので、正常血球細胞の産生もまた損なわれる。白血球数の低下による免疫不全は感染症の危険性を高めることがある一方で、赤血球数の低下は貧血をもたらすことがある。さらに、血小板数の低下は、正常な血液凝固を妨げることがある。加えて、骨髄腫細胞によって産生された余分なグロブリン蛋白質と軽鎖蛋白質が血液の粘度を高めること (過粘稠症候群) により、腎臓において循環障害が起こることがある。これらのタンパク質はまた、腎臓に損害を与えて、急性腎不全や慢性腎不全を引き起こすこともある。骨髄腫細胞が脊柱管に浸潤すると、脊髄圧迫による疼痛などが起こり、さらに進行すると麻痺を生ずる。また、骨髄腫細胞から産生分泌されるM蛋白質に由来するアミロイド蛋白質の蓄積によって末梢神経障害を生ずることもある (アミロイドーシス)。多発性骨髄腫の患者は多くの組

織と臓器が影響を受けるので、その症状と標徴は変わりやすい。

[0003] 以上述べた様に、多発性骨髄腫は様々な合併症を伴う致死的な疾患であるが、完全で恒久的な回復をもたらし、かつ副作用の少ない治療方法はこれまで存在しなかった。そのため、多発性骨髄腫の新しい治療方法は常に求められており、骨髄腫細胞に対して増殖阻害効果を示す低分子化合物を用いて多発性骨髄腫を治療する検討も続けられている。しかしながら、現在まで多発性骨髄腫に対して十分に満足な治療効果を示す低分子化合物は見出されていなかった（例えば、非特許文献1～5参照。）。

一方、ピラゾール化合物は種々の生理活性を示すことが報告されており、当該化合物を基に数多くの農薬や医薬用途の化合物が創出されてきた（例えば、特許文献1～2及び非特許文献6～8参照。）。

先行技術文献

特許文献

[0004] 特許文献1：国際公開第2001/085685号

特許文献2：国際公開第2008/073825号

非特許文献

[0005] 非特許文献1：Blood. 2008年、111巻、2516頁.

非特許文献2：Hematology Am. Soc. Hematol. Educ. Program. 2009年、566頁.

非特許文献3：Hematology Am. Soc. Hematol. Educ. Program. 2009年、578頁.

非特許文献4：Blood. 2007年、110巻、3281頁.

非特許文献5：Clin. Cancer Res. 2009年、15巻、5250頁.

非特許文献6：J. Org. Chem. 1978年、43巻、808頁.

非特許文献7：Chemische Berichte 1992年、125巻、9号、2075頁

非特許文献8：Khimiya Geterotsiklicheskikh Soedinenii 1988年、5巻、710頁

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0006] 本発明の目的は、前記の従来技術の問題を解決し、ピラゾール化合物及び当該化合物を用いた骨髓腫細胞に対する治療剤を提供することにある。

課題を解決するための手段

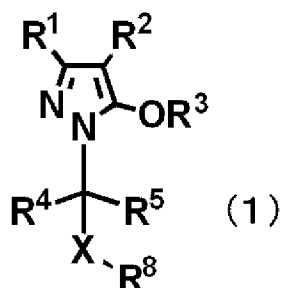
[0007] 本発明者らは、ピラゾール化合物及びそれらを用いた骨髓腫細胞に対する増殖阻害について鋭意研究した結果、新規なピラゾール化合物の合成に成功し、これらの化合物が骨髓腫細胞に対する増殖阻害を示すことを見出し、本発明を完成した。

すなわち、本発明は下記〔１〕～〔１０〕に関するものである。

[0008] 〔１〕

一般式（１）

[0009] [化１]



[式中、 R^1 は、水素原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 R^{17} で置換された $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、ハロゲン原子によって置換された $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、ハロゲン原子によって置換された $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、 $-C(=O)R^{12}$ 、 $-C(=O)OR^{12}$ 、 $-C(=O)N(R^{13})R^{12}$ 、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ 、 $-C(R^{12})=NOR^{13}$ 、 $D1 \sim D23$ 、シアノ、フェニル、 a 個の R^{11} によって置換されたフェニル、ベンジル又はベンゼン環上が a 個の R^{11} で置換されていても良いベンジルを表し、 a が２以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{11} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{11} は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{N}-$ 又は $-\text{N}=\text{CHN}=\text{CH}-$ を形成することにより、2つの R^{11} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $\text{C}_1\sim\text{C}_{10}$ アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_{10}$ シクロアルキル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_{10}$ アルケニル、ハロゲン原子によって置換された $\text{C}_2\sim\text{C}_{10}$ アルケニル、 $\text{C}_2\sim\text{C}_{10}$ アルキニル、ハロゲン原子によって置換された $\text{C}_2\sim\text{C}_{10}$ アルキニル、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})\text{R}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12})=\text{NR}^{13}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12})=\text{NOR}^{13}$ 、D1～D23、ベンジル、ベンゼン環上がe個の R^{21} で任意に置換されたベンジル、フェニル又はe個の R^{21} で任意に置換されたフェニルを表し、eが2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{N}-$ 又は $-\text{N}=\text{CHN}=\text{CH}-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^3 は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^{31} によって任意に置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^{31} によって任意に置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{12})R^{13}$ 、 $-Si(R^{32})(R^{33})R^{34}$ 、ベンジル又はベンゼン環上が g 個の R^{15} で置換されていてもよいベンジルを表し、 g が2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

X は、単結合又は $-(CR^6R^7)_n-$ を表し、

R^4 及び R^5 は、各々独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表し、さらに R^4 と R^5 が $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 又は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$ を形成することにより R^4 と R^5 がそれぞれ結合する炭素原子と共に3員環、4員環、5員環又は6員環を形成してもよく、

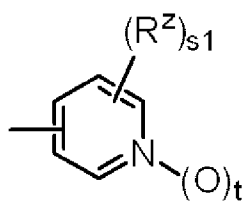
R^6 及び R^7 は、各々独立して水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^8 は、 $D1 \sim D23$ 、 $E1 \sim E8$ 、 $M1 \sim M9$ 、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $F1$ 、 $F2$ 、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、フェニル又は k 個の R^{81} で任意に置換されたフェニルを表し、 k が2以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

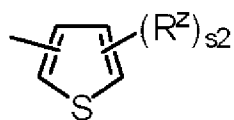
さらに、2つの R^{81} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{81} は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(R^y)-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(R^y)\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(R^y)\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(R^y)\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(R^y)\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{N}-$ 又は $-\text{N}=\text{CHN}=\text{CH}-$ を形成することにより、2つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

$D1 \sim D23$ は、それぞれ下記の構造式で表される芳香族複素環を表し、

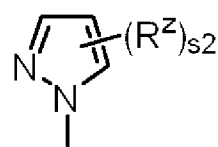
[0010] [化2]



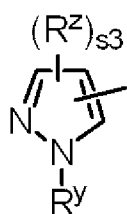
D1



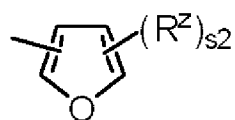
D2



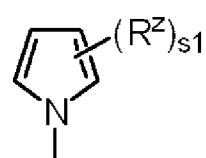
D3



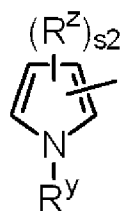
D4



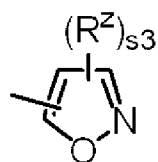
D5



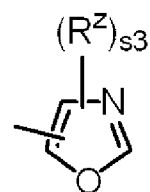
D6



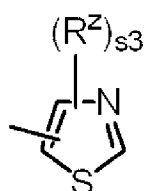
D7



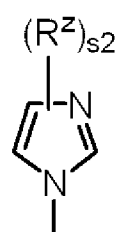
D8



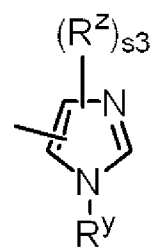
D9



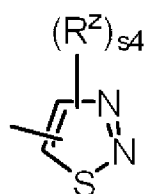
D10



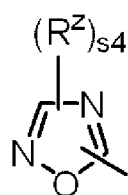
D11



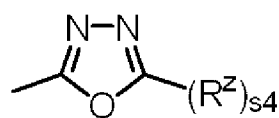
D12



D13

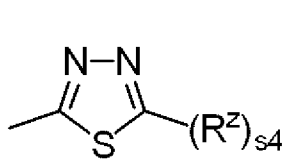


D14

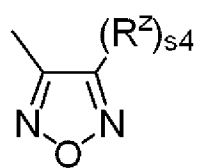


D15

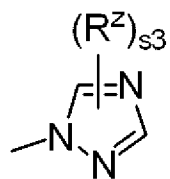
[0011] [化3]



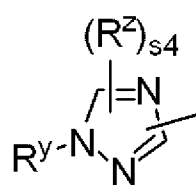
D16



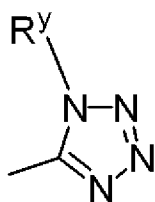
D17



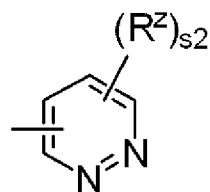
D18



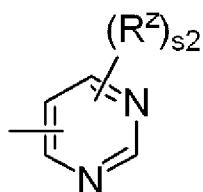
D19



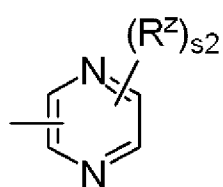
D20



D21



D22

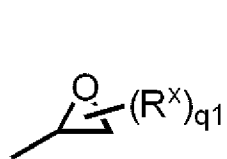


D23

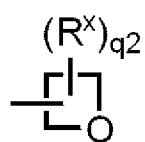
E1～E8は、それぞれ下記の構造式で表される飽和複素環を表し、

[0012]

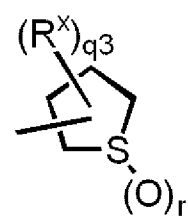
[化4]



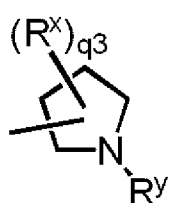
E1



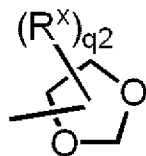
E2



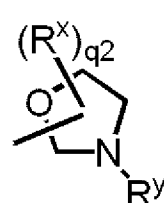
E3



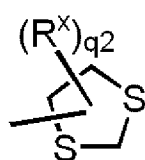
E4



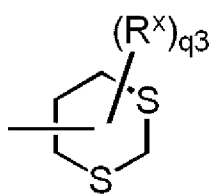
E5



E6



E7

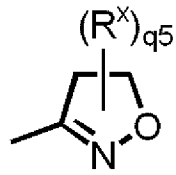


E8

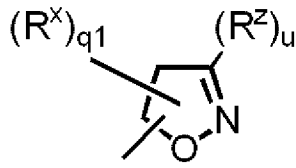
M1～M9は、それぞれ下記の構造式で表される部分不飽和芳香族複素環を表し、

[0013]

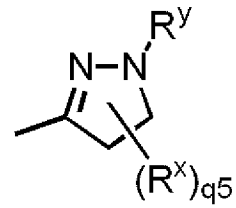
[化5]



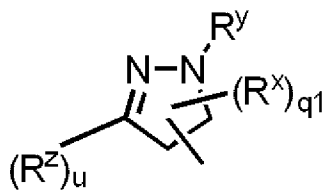
M1



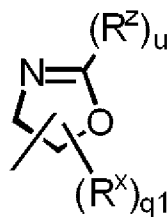
M2



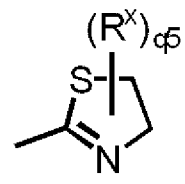
M3



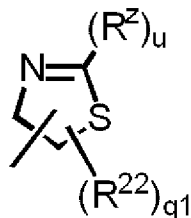
M4



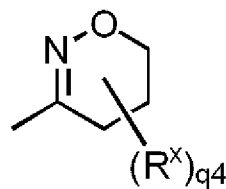
M5



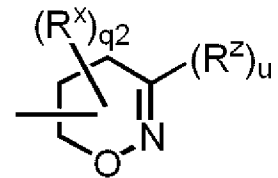
M6



M7



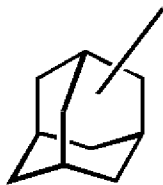
M8



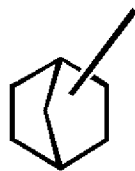
M9

F1～F2は、それぞれ下記の構造式で表される環を表し、

[化6]



F1



F2

R^xは、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、 $-OR^{82}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、フェニル、d個のR¹⁵で置換されていても良いフェニル、ベンジル又はベンゼン環上がd個のR¹⁵で置換されていても良いベンジルを表し、dが2以上の整数を表すとき、各

々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^y は、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、フェニル、 d 個の R^{15} で置換されていても良いフェニル、ベンジル又はベンゼン環上が d 個の R^{15} で置換されていても良いベンジルを表し、 d が2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^z は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルコキシ、アルキルスルホニルオキシ、ハロアルキルスルホニルオキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(S)NH_2$ 、 $-S(O)_2NH_2$ 、フェノキシ、フェニル又は m 個の R^{16} で置換されていても良いフェニルを表し、 m が2以上の整数を表すとき、各々の R^{16} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 $s1$ 、 $s2$ 又は $s3$ が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^z が隣接する場合には、隣接する2つの R^z は $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2N(R^y)-$ 、 $-CH_2N(R^y)CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2CH=CH-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-SCH=CH-$ 、 $-N(R^y)CH=CH-$ 、 $-OCH=N-$ 、 $-SCH=N-$ 、 $-N(R^y)CH=N-$ 、 $-N(R^y)N=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 、 $-OCH_2CH=CH-$ 、 $-N=CHCH=CH-$ 、 $-N=CHCH=N-$ 又は $-N=CHN=CH-$ を形成することにより、2つの R^z のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

[0014] R^{11} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アル

コキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルコキシ、ニトロ、シアノ又はフェニルを表し、 R^{12} 及び R^{13} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、D1～D23、ベンジル、ベンゼン環上が b 個の R^{14} で任意に置換されていても良いベンジル、フェニル又は b 個の R^{14} で任意に置換されていても良いフェニルを表し、 b が 2 以上の整数を表すとき、各々の R^{14} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{14} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{14} は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$, $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$, $-\text{OCH}_2\text{O}-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$, $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)-$, $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$, $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{OCH}=\text{CH}-$, $-\text{SCH}=\text{CH}-$, $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{OCH}=\text{N}-$, $-\text{SCH}=\text{N}-$, $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{N}-$, $-\text{N}(\text{R}^y)\text{N}=\text{CH}-$, $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$, $-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{CH}-$, $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{N}-$ 又は $-\text{N}=\text{CHN}=\text{CH}-$ を形成することにより、2つの R^{14} のそれぞれが結合する炭素原子と共に 5 員環又は 6 員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に 2 個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{14} は、ハロゲン原子、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルコキシ、フェノキシ又はフェニルを表し、

R^{15} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルコキシ、ニトロ、シアノ又はフェニルを表し、

R^{16} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルコキシ、ニトロ、シアノ又はフェニルを表し、さらに2つの R^{16} が隣接する場合には、隣接する2つ

の R^{16} は $-OCH_2O-$ を形成することにより、2つの R^{16} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環を形成してもよく、

R^{17} は、 $-C(O)OR^{12}$ 、フェニル又は a 個の R^{11} によって置換されたフェニルを表し、 a が2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{21} は、ハロゲン原子、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $-OR^{23}$ 、 $-C(O)R^{24}$ 、 $-C(O)OR^{24}$ 、 $-NR^{24}R^{25}$ 、 $-C(O)NR^{24}R^{25}$ 、 $-S(O)_2NR^{24}R^{25}$ 、フェニル又は f 個の R^{22} で置換されていても良いフェニルを表し、 f が2以上の整数を表すとき、各々の R^{22} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{22} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{22} は $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2N(R^y)-$ 、 $-CH_2N(R^y)CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2CH=CH-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-SCH=CH-$ 、 $-N(R^y)CH=CH-$ 、 $-OCH=N-$ 、 $-SCH=N-$ 、 $-N(R^y)CH=N-$ 、 $-N(R^y)N=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 、 $-OCH_2CH=CH-$ 、 $-N=CHCH=CH-$ 、 $-N=CHCH=N-$ 又は $-N=CHN=CH-$ を形成することにより、2つの R^{22} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{22} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルコキシ、ニトロ、シアノ又はフェニルを表し、

R^{23} は、水素原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、フェニル、 f 個の R^{22} で置換されていても良いフェニル、ベンジル又はベンゼン環

上が f 個の R^{22} で置換されていても良いベンジルを表し、 f が2以上の整数を表すとき、各々の R^{22} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{24} 及び R^{25} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、ベンジル、ベンゼン環上が b 個の R^{14} で任意に置換されていても良いベンジル、1-フェネチル、ベンゼン環上が b 個の R^{14} で任意に置換されていても良い1-フェネチル、2-フェネチル、ベンゼン環上が b 個の R^{14} で任意に置換されていても良い2-フェネチル、フェニル又は b 個の R^{14} で任意に置換されていても良いフェニルを表し、 b が2以上の整数を表すとき、各々の R^{14} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

[0015] R^{31} は、ハロゲン原子又はフェニルを表し、

R^{32} 、 R^{33} 及び R^{34} は、各々独立して $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、ベンジル、ベンゼン環上が b 個の R^{14} で任意に置換されていても良いベンジル、フェニル又は b 個の R^{14} で任意に置換されていても良いフェニルを表し、 b が2以上の整数を表すとき、各々の R^{14} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{81} は、ハロゲン原子、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $-OR^{23}$ 、 $-C(R^{83})=NR^{84}$ 、 $-C(R^{83})=NOR^{84}$ 、 $-C(O)R^{24}$ 、 $-C(O)OR^{24}$ 、 $-S(O)cR^{24}$ 、 $-OS(O)_2R^{24}$ 、 $-NR^{24}R^{25}$ 、 $-C(O)NR^{24}R^{25}$ 、 $-C(S)NH_2$ 、 $-S(O)_2NR^{24}R^{25}$ 、フェニル又は m 個の R^{22} で置換されていても良いフェニルを表し、 m が2以上の整数を表すとき、各々の R^{22} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{82} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、フェニル、 d 個の R^{15} で置換されていても良いフェニル、ベンジル又はベンゼン環上が d 個の R^{15} で置換されていても良いベンジルを表し、 d が2以上の整数を表すと

き、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{83} 及び R^{84} は、各々独立して水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルキル、フェニル、 d 個の R^{15} で置換されていても良いフェニル、ベンジル又はベンゼン環上が d 個の R^{15} で置換されていても良いベンジルを表し、 d が2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

Z は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルコキシ、アルキルスルホニルオキシ、ハロアルキルスルホニルオキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(S)NH_2$ 、又は $-S(O)_2NH_2$ を表し、

a, b, d, e, f, g, k 及び m は1～5の整数を表し、

c は0～2の整数を表し

q_1 は0～3の整数を表し、

q_2 は0～5の整数を表し、

q_3 は0～7の整数を表し、

q_4 は0～6の整数を表し、

q_5 は0～4の整数を表し、

r は0～2の整数を表し、

s_1 は0～4の整数を表し、

s_2 は0～3の整数を表し、

s_3 は0～2の整数を表し、

s_4 は0又は1の整数を表し、

n は1の整数を表し、

t は0又は1の整数を表し、

u は0又は1の整数を表す。]

で表されるピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[0016] [2]

Xは $-(CR^6R^7)_n-$ を表す上記〔1〕記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[3]

R^1 は、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 R^{17} で置換された $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{13})R^{12}$ 、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ 、 $-C(R^{12})=NOR^{13}$ 、 $D1\sim D12$ 、 $D18$ 、 $D19$ 、 $D21\sim D23$ 、フェニル又は a 個の R^{11} によって置換されたフェニルを表し、 a が2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つの R^{11} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{11} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 又は $-N=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{11} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^2 は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $D1$ 、 $D2$ 、 $D4\sim D12$ 、 $D18$ 、 $D19$ 、 $D21\sim D23$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、ベンジル、ベンゼン環上が e 個の R^{21} で任意に置換されたベンジル、フェニル又は e 個の R^{21} で任意に置換されたフェニルを表し、 e が2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^3 は、水素原子、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_3\sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ($C_1\sim C_4$)アルキル、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{12})R^{13}$ 、 $-Si(R^{32})(R^{33})R^3$

4、ベンジル又はベンゼン環上が g 個の R^{15} で置換されていてもよいベンジルを表し、 g が2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^4 及び R^5 は、各々独立して $C_1\sim C_4$ アルキルを表し

R^6 及び R^7 は、水素原子を表し

R^8 は、D1、D2、D4、D5、D7～D12、D19、D22、D23、E1～E8、F1、F2、 $C_3\sim C_{10}$ シクロアルキル、フェニル又は k 個の R^{81} で任意に置換されたフェニルを表し、 k が2以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく

さらに、2つの R^{81} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{81} は $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 又は $-N=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

[0017] R^x は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル又はフェニルを表し、

R^y は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、フェニル又は d 個の R^{15} で置換されていてもよいフェニルを表し、 d が2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^z は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、フェノキシ、フェニル又は m 個の R^{16} で置換されていてもよいフェニルを表し、 m が2以上の整数を表すとき、各々の R^{16} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 s_1 、 s_2 又は s_3 が2以上の整数を表すとき、各々の R_z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{11} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_1\sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ ($C_1\sim C_6$) アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ ($C_1\sim C_6$) アルコキシ、ニトロ又はフェニルを表し、

R^{12} 及び R^{13} は、各々独立して水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロシクロアルキル、D2、D4、D5、D7、D21、D22、D23、ベンジル、ベンゼン環上がb個の R^{14} で任意に置換されていても良いベンジル、フェニル又はb個の R^{14} で任意に置換されていても良いフェニルを表し、bが2以上の整数を表すとき、各々の R^{14} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{14} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{14} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 又は $-N=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{14} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{14} は、ハロゲン原子、ニトロ、シアノ、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、フェノキシ又はフェニルを表し、

R^{15} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ又は $C_1\sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R^{16} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_1\sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルキル又は $C_1\sim C_{10}$ ハロアルコキシを表し、さらに、2つの R^{16} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{16} は $-OCH_2O-$ を形成することにより、2つの R^{16} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環を形成してもよく、

R^{21} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_3\sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ ($C_1\sim C_6$) アルコキシ、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、フェノキシ、フェニル又はf個の R^{22} で置換されていても良いフェニルを表し、fが2以上の整数を表すとき、各々の R^{22} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

[0018] R^{22} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_1\sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルキル又は $C_1\sim C_{10}$ ハロアルコキシを表し、さらに、2つの R^{22} が隣接する場合には

、隣接する2つの R^{22} は $-OCH_2O-$ を形成することにより、2つの R^{22} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環を形成してもよく、

R^{32} 、 R^{33} 及び R^{34} は、各々独立して $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、ベンジル、ベンゼン環上が b 個の R^{14} で任意に置換されていても良いベンジル、フェニル又は b 個の R^{14} で任意に置換されていても良いフェニルを表し、 b が2以上の整数を表すとき、各々の R^{14} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{81} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ($C_1\sim C_6$)アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ($C_1\sim C_6$)アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、ニトロ又はシアノを表し、 Z は、ハロゲン原子又は $C_1\sim C_6$ アルキルを表す上記〔2〕記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[0019] 〔4〕

R^1 は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^{17} で置換された $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $D2$ 、 $D4$ 、 $D5$ 、 $D7$ 、 $D21\sim D23$ 、フェニル又は a 個の R^{11} によって置換されたフェニルを表し、 a が2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つの R^{11} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{11} は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{11} のそれぞれが結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^2 は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $D2$ 、 $D7$ 、ベンジル、ベンゼン環上が e 個の R^{21} で任意に置換されたベンジル、フェニル又は e 個の R^{21} で任意に置換されたフェニルを表し、 e が2以上の整数を

表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、

さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されているとしてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、

R^3 は、水素原子、 $C_1\sim C_4$ アルキル、 $C_3\sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_4$ アルコキシ ($C_1\sim C_4$) アルキル、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{12})R^{13}$ 、 $-Si(R^{32})(R^{33})R^{34}$ 又はベンジルを表し、

R^8 は、D2、D7、D23、F1、F2、フェニル又はk個の R^{81} で任意に置換されたフェニルを表し、kが2以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、

さらに、2つの R^{81} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{81} は $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されているとしてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、

R^y は、 $C_1\sim C_6$ アルキル又はフェニルを表し、

R^z は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、フェノキシ、フェニル又はm個の R^{16} で置換されているフェニルを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々の R^{16} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、s2又はs3が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、

R^{12} 及び R^{13} は、各々独立して水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル又は $C_3\sim C_6$ シクロアルキルを表し、

R^{16} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシを表し、

R^{17} は $-C(OR^{12})$ 又はフェニルを表し、

R^{22} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシを表し、

R^{32} 、 R^{33} 及び R^{34} は、各々独立して $C_1\sim C_6$ アルキル又は $C_3\sim C_6$ シクロアルキルを表し、 R^{81} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルコキシ、 $C_1\sim C_2$ アルコキシ ($C_1\sim C_2$) アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルキル、フェニル又はフェノキシを表す上記〔3〕記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[0020] [5]

R^1 は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^{17} で置換された $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、フェニル又は a 個の R^{11} によって置換されたフェニルを表し、 a が2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^2 は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、D2、ベンジル、ベンゼン環上が e 個の R^{21} で任意に置換されたベンジル、フェニル又は e 個の R^{21} で任意に置換されたフェニルを表し、 e が2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^3 は、水素原子を表し、

R^8 は、D2、F1、F2、フェニル、又は k 個の R^{81} で任意に置換されたフェニルを表し、 k が2以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{81} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{81} は $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^z は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、フェノキシ又はフェニルを表し、 s が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 R^{11} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ又はニトロを表し、

R^{12} は、 $C_1\sim C_6$ アルキルを表し、

R^{17} は $-C(O)OR^{12}$ 又はフェニルを表し、

R^{21} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_2$ アルコキシ($C_1\sim C_2$)アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、ニトロ、シアノ又はフェニルを表し、

R^{81} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、フェニル又はフェノキシを表す上記〔4〕記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[0021] [6]

R^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 R^{17} で置換された $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_3\sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_2\sim C_{10}$ アルケニル、ハロゲン原子によって置換された $C_2\sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2\sim C_{10}$ アルキニル、ハロゲン原子によって置換された $C_2\sim C_{10}$ アルキニル、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ 、 $-C(R^{12})=NOR^{13}$ 、D1～D23、ベンジル、ベンゼン環上が e 個の R^{21} で任意に置換された

ベンジル、フェニル又は e 個の R^{21} で任意に置換されたフェニルを表し、 e が2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{N}-$ 又は $-\text{N}=\text{CHN}=\text{CH}-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

Xは単結合を表す上記〔1〕記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[0022] [7]

R^1 は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_{10}$ アルキル、 R^{17} で置換された $\text{C}_1\sim\text{C}_{10}$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})\text{R}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12})=\text{NOR}^{13}$ 、D1～D12、D18、D19、D21～D23、フェニル又は a 個の R^{11} によって置換されたフェニルを表し、 a が2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{11} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{11} は $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ を形成することにより、2つの R^{11} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^2 は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、D1、D2、D4～D12、D18、D1

9、D21～D23、ベンジル、ベンゼン環上がe個のR²¹で任意に置換されたベンジル、フェニル又はe個のR²¹で任意に置換されたフェニルを表し、eが2以上の整数を表すとき、各々のR²¹は互いに同一であっても又は互いに相異なっているてもよく、

さらに、2つのR²¹が隣接する場合には、隣接する2つのR²¹は-OCH₂O-, -OCH₂CH₂O-, -OCH=CH-又は-CH=CHCH=CH-を形成することにより、2つのR²¹のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されているてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なっているてもよく、

R³は、水素原子、C₁～C₄アルキル、C₃～C₄シクロアルキル、C₁～C₄アルコキシ(C₁～C₄)アルキル、-C(O)R¹²、-C(O)OR¹²、-C(O)N(R¹²)R¹³、-Si(R³²)(R³³)R³

4、ベンジル又はベンゼン環上がg個のR¹⁵で置換されているてもよいベンジルを表し、gが2以上の整数を表すとき、各々のR¹⁵は互いに同一であっても又は互いに相異なっているてもよく、

R⁴及びR⁵は、各々独立してC₁～C₄アルキルを表し、

R⁸は、D1、D2、D4、D5、D7～D12、D19、D22、D23、E1～E9、F1、F2、C₃～C₁₀シクロアルキル、フェニル又はk個のR⁸¹で任意に置換されたフェニルを表し、kが2以上の整数を表すとき、各々のR⁸¹は互いに同一であっても又は互いに相異なっているてもよく、

さらに、2つのR⁸¹が隣接する場合には、隣接する2つのR⁸¹は-OCH₂O-, -CH₂CH₂CH₂-, -OCH₂CH₂O-, -OCH=CH-, -CH=CHCH=CH-又は-N=CHCH=CH-を形成することにより、2つのR⁸¹のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されているてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なっているてもよく、

R^xは、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル又はフェニルを表し

R^y は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、フェニル又は d 個の R^{15} で置換されていても良いフェニルを表し、 d が2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^z は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、フェノキシ、フェニル又は m 個の R^{16} で置換されていても良いフェニルを表し、 m が2以上の整数を表すとき、各々の R^{16} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 s_1 、 s_2 又は s_3 が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{11} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_1\sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ ($C_1\sim C_6$) アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ ($C_1\sim C_6$) アルコキシ、ニトロ又はフェニルを表し、

[0023] R^{12} 及び R^{13} は、各々独立して水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルキル、 D_2 、 D_4 、 D_5 、 D_7 、 D_{21} 、 D_{22} 、 D_{23} 、ベンジル、ベンゼン環上が b 個の R^{14} で任意に置換されていても良いベンジル、フェニル又は b 個の R^{14} で任意に置換されていても良いフェニルを表し、 b が2以上の整数を表すとき、各々の R^{14} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{14} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{14} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 又は $-N=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{14} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{14} は、ハロゲン原子、ニトロ、シアノ、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、フェノキシ又はフェニルを表し、

R^{15} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ又は $C_1\sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R¹⁶は、ハロゲン原子、C₁~C₁₀アルキル、C₁~C₁₀アルコキシ、C₁~C₁₀ハロアルキル又はC₁~C₁₀ハロアルコキシを表し、さらに、2つのR¹⁶が隣接する場合には、隣接する2つのR¹⁶は-OCH₂O-を形成することにより、2つのR¹⁶のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環を形成してもよく、

R²¹は、ハロゲン原子、C₁~C₁₀アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₁₀アルコキシ、C₁~C₆アルコキシ (C₁~C₆) アルコキシ、C₁~C₁₀ハロアルキル、C₁~C₁₀ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、フェノキシ、フェニル又はf個のR²²で置換されていても良いフェニルを表し、fが2以上の整数を表すとき、各々のR²²は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R²²は、ハロゲン原子、C₁~C₁₀アルキル、C₁~C₁₀アルコキシ、C₁~C₁₀ハロアルキル又はC₁~C₁₀ハロアルコキシを表し、さらに、2つのR²²が隣接する場合には、隣接する2つのR²²は-OCH₂O-を形成することにより、2つのR²²のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環を形成してもよく、

R³²、R³³及びR³⁴は、各々独立してC₁~C₆アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、ベンジル、ベンゼン環上がb個のR¹⁴で任意に置換されていても良いベンジル、フェニル又はb個のR¹⁴で任意に置換されていても良いフェニルを表し、bが2以上の整数を表すとき、各々のR¹⁴は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R⁸¹は、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₃~C₆シクロアルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、C₃~C₆ハロシクロアルコキシ、C₁~C₆アルコキシ (C₁~C₆) アルキル、C₁~C₆アルコキシ (C₁~C₆) アルコキシ、C₃~C₆シクロアルキル、C₃~C₆ハロシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、ニトロ又はシアノを表し、Zは、ハロゲン原子又はC₁~C₆アルキルを表す上記〔6〕記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[0024] [8]

R¹は、C₁~C₆アルキル、R¹⁷で置換されたC₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₃~C₆シクロアルキル、-C(O)OR¹²、D2、D4、D5、D7、D21、D23、フェニ

ル又はa個の R^{11} によって置換されたフェニルを表し、aが2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つの R^{11} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{11} は $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ を形成することにより、2つの R^{11} のそれぞれが結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^2 は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、D2、D7、ベンジル、ベンゼン環上がe個の R^{21} で任意に置換されたベンジル、フェニル又はe個の R^{21} で任意に置換されたフェニルを表し、eが2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^3 は、水素原子、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_4$ シクロアルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルコキシ ($\text{C}_1\sim\text{C}_4$) アルキル、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{12})\text{R}^{13}$ 、 $-\text{Si}(\text{R}^{32})(\text{R}^{33})\text{R}^{34}$ 又はベンジルを表し、

R^8 は、D2、D7、D23、F1、F2、フェニル又はk個の R^{81} で任意に置換されたフェニルを表し、kが2以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{81} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{81} は $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 又は $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ を形成することにより、2つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていて

もよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^y は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又はフェニルを表し、

R^z は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェノキシ、フェニル又はm個の R^{16} で置換されていても良いフェニルを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々の R^{16} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、s2又はs3が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{12} 及び R^{13} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表し、

R^{16} はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシを表し、

R^{17} は $-C(0)OR^{12}$ 又はフェニルを表し、

R^{22} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシを表し、

R^{32} 、 R^{33} 及び R^{34} は、各々独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表し、 R^{81} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ ($C_1 \sim C_2$) アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル又はフェノキシを表す上記〔7〕記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[0025] 〔9〕

R^1 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{17} で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、フェニル又はa個の R^{11} によって置換されたフェニルを表し、aが2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^2 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、D2、ベンジル、ベンゼン環上がe個の R^{21} で任意に置

換されたベンジル、フェニル又は e 個の R^{21} で任意に置換されたフェニルを表し、 e が2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、

さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されているとしてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、

R^3 は、水素原子を表し、

R^8 は、 D_2 、 F_1 、 F_2 、フェニル又は k 個の R^{81} で任意に置換されたフェニルを表し、 k が2以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよくさらに、2つの R^{81} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{81} は $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されているとしてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、

R^z は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェノキシ又はフェニルを表し、 s が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、

R^{11} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ又はニトロを表し、

R^{12} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^{17} は $-C(O)OR^{12}$ 又はフェニルを表し、

R^{21} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ ($C_1 \sim C_2$) アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ニトロ、シアノ又はフェニルを表し、

R⁸¹は、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ又はフェノキシを表す上記〔8〕記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[0026] 〔10〕

上記〔1〕～〔9〕の何れか1項に記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物を有効成分として含有する多発性骨髄腫の治療剤。

発明の効果

[0027] 当該発明の化合物は、骨髄腫細胞の増殖を阻害する効果を有するため、多発性骨髄腫に対する治療剤として有用であり、当該疾患の予防・治療・改善薬として用いることができる。

発明を実施するための形態

[0028] 以下、更に詳細に本発明を説明する。

本明細書において用いる用語につき、以下の通り定義する。

[0029] 本発明は、骨髄腫細胞の増殖を阻害する活性を有する化合物を使用することにより病態の改善が期待できる時に使用される。本発明の化合物を含有する治療剤の対象となる疾患としては、多発性骨髄腫が挙げられる。多発性骨髄腫は、形質細胞の腫瘍であるが、その病期は国際病期分類システム（International Staging System、ISS）を使用することによって決定される。すなわち、病期Ⅰ：血清β2ミクログロブリン3.5mg/L未満で、かつ血清アルブミン3.5g/dL以上、病期Ⅱ：病期Ⅰ又はⅢのいずれにも該当しないもの、病期Ⅲ：血清β2ミクログロブリン5.5mg/L以上、の3つに分類されている。

[0030] また、多発性骨髄腫は、無症候性又は症候性に分類される。無症候性骨髄腫患者は、M蛋白質が多く、骨髄の骨髄腫細胞が10%以上であることから骨髄腫の基準を満たすが、関連する臓器又は組織の障害又は症状を示さない。無症候性骨髄腫には、くすぶり型多発性骨髄腫、緩慢型多発性骨髄腫、及び病期Ⅰの多発性骨髄腫が含まれる。骨髄腫に関連する臓器又は組織の障害と

しては、高カルシウム血症、腎臓機能障害、貧血、感染症、過粘稠度症候群、アミロイドーシス及び骨病変などが挙げられるが、症候性骨髄腫は、これらの臓器又は組織の障害のうち一つでも示す場合をいう。その他、血液や尿にM蛋白質が検出されない非分泌型骨髄腫、骨に1ヵ所だけ病変ができる骨の形質細胞腫、骨髄外で骨髄腫細胞ががんを形成する髄外性形質細胞腫、或いは末梢血液中に形質細胞が検出される形質細胞性白血病が、多発性骨髄腫の類縁疾患として分類されている。

[0031] 多発性骨髄腫はまた、治療に応じて、以下のカテゴリに分類される

応答型：治療法に応答型である骨髄腫を指す。少なくとも50%のM蛋白質の減少がある。

安定型：治療に応答していない（M蛋白質の減少が50%に達していない）が、進行が認められない骨髄腫。

進行型：悪化（すなわち、Mタンパクの増加、及び臓器又は組織障害の悪化）している活発な骨髄腫。

再発型：初期には治療法に応答したが、その後、再び進行し始めた骨髄腫。患者は、初期治療後又はその後の治療法後に再発したとしてさらに分類されることがある。

難治型：初期治療法に応答しなかった骨髄腫、並びにその後の治療に応答しない再発型骨髄腫。

本発明の化合物により治療される多発性骨髄腫は、先に記載したあらゆる病期、分類、類縁疾患、カテゴリ、及び疾患状態にあるものであり得る。

[0032] 本発明の化合物は、単独で、又は多発性骨髄腫の1つ以上の症状を低減するのに使用される他の少なくとも1種類の治療薬と組み合わせて使用されてもよい。その際、本発明の化合物は、当該治療薬と共に同時に投与されてもよく、あるいは、当該治療薬の投与に先立って、又はその後に投与されてもよい。本発明の化合物は、当該治療薬と同じか、又は異なった投与経路により投与されてもよい。当該治療薬としては、化学療法薬、支持治療薬、又はその組み合わせが挙げられる。

[0033] 本明細書中に使用される化学療法薬は、癌細胞に対して増殖阻害を示す物質である。その例としては、ボルテゾミブ（ベルケイド（V e l c a d e（登録商標）））、メルファラン、プレドニゾン（P r e d i s o n e）、ビンクリスチン、カルムスチン、シクロホスファミド、デキサメサゾン、サリドマイド、ドキシソルビシン、シスプラチン、エトポシド、及びシタラビンが挙げられるが、これらに限られるわけではない。

「支持治療薬」は、多発性骨髄腫の症状と合併症を軽減するための作用物質である。その例としては、抗生物質、ビスホスホナート、血球増殖因子、利尿剤、及び鎮痛剤が挙げられるが、これらに限られるわけではない。

[0034] 抗生物質の例としては、サルファ製剤、ペニシリン、フェネチシリン、メチシリン、オキサシリン、クロキサシリン、ジクロキサシリン、フルクロキサシリン、ナフシリン、アンピシリン、アモキシシリン、シクラシリン、カルベニシリン、チカルシリン、ピペラシリン、アズロシリン、メクスロシリン、メシリナム、アンジノシリン、セファロスポリン及びその誘導体、オキシリン酸、アミフロキサシン、テマフロキサシン、ナリジクス酸、ピロミド酸、シプロフロキサシン、シノキサシン、ノルフロキサシン、パーフロキサシン、ロザキサシン、オフロキサシン、エノキサシン、ピペミド酸、スルバクタム、クラブリン酸、 β -ブロモペニシラン酸、 β -クロロペニシラン酸、6-アセチルメチレン-ペニシラン酸、セフォキサゾール、スルタンピシリン、アディノシリン及びスルバクタムのホルムアルデヒド・フドレートエステル、タゾバクタム、アズトレオナム、スルファゼチン、イソスルファゼチン、ノルカディシン、m-カルボキシフェニル、フェニルアセトアミドホスホン酸メチル、クロルテトラサイクリン、オキシテトラサイクリン、テトラサイクリン、デメクロサイクリン、ドキシサイクリン、メタサイクリン、並びにミノサイクリンが挙げられる。

ビスホスホナートの例としては、エチドロナート（D i d r o n e l）、パミドロナート（A r e d i a）、アレンドロナート（F o s a m a x）、リセドロナート（A c t o n e l）、ゾレドロナート（Z o m e t a）、イ

バンドロナート (Boniva) が挙げられる。

利尿剤の例としては、例えば、アミロライド、クロロチアジド、ヒドロクロロチアジド、メチルクロロチアジド、クロロサリドンなどのチアジド誘導体が挙げられる。

[0035] 血球増殖因子の例としては、顆粒球コロニー刺激因子 (G-CSF)、顆粒球マクロファージコロニー刺激因子 (GM-CSF)、マクロファージコロニー刺激因子 (M-CSF)、エリスロポイエチン、トロンボポイエチン、オンコスタチンM、及び各種インターロイキンが挙げられる。

鎮痛剤の例としては、オピオイド、COX-2阻害剤（例えば、ロフェコキシブ、バルデコキシブ、及びセレコキシブ）、サリチラート（例えば、アスピリン、トリサリチル酸コリン・マグネシウム、サルサラート、ジフニサル、及びサリチル酸ナトリウム）、プロピオン酸誘導体（例えば、フェノプロフェン・カルシウム、イブプロフェン、ケトプロフェン、ナプロキセン、及びナプロキセン・ナトリウム）、インドール酢酸誘導体（例えば、インドメタシン、スルフィンダック、エトダラック、及びトルメチン）、フェナマート（例えば、メフェナム酸及びメクロフェナマート）、ベンゾチアジン誘導体又はオキシカム（例えば、モビック又はピロキシカム）、あるいは、ピロール酢酸（例えば、ケトロラク）が挙げられる。

[0036] 本明細書中において「治療する」とは、疾患の程度を部分的又は完全に軽減すること、疾患に関連する臨床的症状又は指標が改善するか又は向上すること、疾患の進行を遅らせるか、抑制するか、又は予防すること、或いは疾患の発症又は進行を部分的又は完全に遅らせるか、抑制するか、又は予防すること、の1つ以上を部分的又は実質的に達成することが含まれる。

本発明の化合物による治療の対象となる動物は、哺乳動物であり、好ましくはヒトであるが、ペット（例えば、イヌ、ネコ等）或いは家畜（ウシ、ヒツジ、ブタ、ウマ等）であってもよい。

また、本発明の化合物を有効成分として含有する治療剤は、通常錠剤、カプセル剤、散剤、顆粒剤、丸剤、シロップ剤などの経口投与剤、直腸投与剤

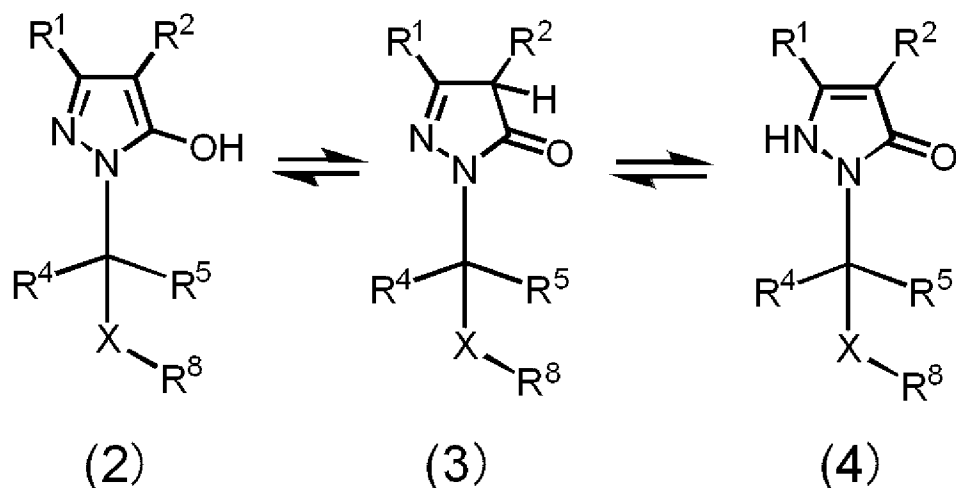
、経皮吸収剤あるいは注射剤として投与できる。本剤は1個の治療剤として、あるいはほかの治療剤との混合物として投与できる。それらは単体で投与してもよいが、一般的には医薬組成物の形態で投与する。それらの製剤は、薬理的、製剤学的に許容しうる添加物を加え、常法により製造することができる。すなわち、経口剤には通常の賦形剤、滑沢剤、結合剤、崩壊剤、湿潤剤、可塑剤、コーティング剤などの添加物を使用することができる。経口用液剤は、水性又は油性懸濁液、溶液、乳濁液、シロップ、エリキシルなどの形態であってもよく、あるいは使用前に水又はほかの適当な溶媒で調製するドライシロップとして供されてもよい。前記の液剤は、懸濁化剤、香料、希釈剤あるいは乳化剤のような通常の添加剤を含むことができる。直腸内投与する場合は座剤として投与することができる。坐剤はカカオ脂、ラウリン脂、マクロゴール、グリセロゼラチン、ウィテップゾール、ステアリン酸ナトリウム又はそれらの混合物など、適当な物質を基剤として用い、必要に応じて乳化剤、懸濁化剤、保存剤などを加えることができる。注射剤は、水性剤形あるいは用時溶解型剤形を形成するために、注射用蒸留水、生理食塩水、5%ブドウ糖溶液、プロピレングリコールなどの溶解剤ないし溶解補助剤、pH調節剤、等張化剤、安定化剤などの製剤成分が使用される。

[0037] 本発明の化合物を含有する治療剤をヒトに投与する場合は、その投与量を患者の年齢、状態により決定するが通常成人の場合、経口剤あるいは直腸内投与では0.1～1000mg/ヒト/日程度、注射剤で0.05mg～500mg/ヒト/日程度である。これらの数値はあくまでも例示であり、投与量は患者の症状にあわせて決定されるものである。

一般式(1)で表される本発明化合物において、置換基 R^3 が水素原子を表す場合、環内異性化により、互変異性体(2)～(4)の存在する場合があるが、本発明には、これら互変異性体(2)～(4)又は互変異性体の任意の割合の混合物を包含するものである。

[0038]

[化7]



本発明に包含される化合物には、異性化により生じるか否かに拘わらず、不斉中心を有する場合は、分割された光学異性体或いはそれらを任意の比率で含む混合物を包含するものである。

本発明に包含される化合物には、異性化により生じるか否かに拘わらず、置換基の種類によってE-体及びZ-体の幾何異性体が存在する場合があるが、本発明はこれら幾何異性体又は幾何異性体の任意の割合の混合物を包含するものである。

[0039] 一般式(1)で示される本発明化合物は、必要に応じて製薬上許容され得る塩に変換することも、又は生成した塩から遊離させることもできる。本発明に包含される化合物のうちで、常法に従って酸付加塩にすることができるものは、例えば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸、沃化水素酸等のハロゲン化水素酸の塩、硝酸、硫酸、リン酸、塩素酸、過塩素酸等の無機酸の塩、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸の塩、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、フマル酸、酒石酸、蔞酸、マレイン酸、リンゴ酸、コハク酸、安息香酸、マンデル酸、アスコルビン酸、乳酸、グルコン酸、クエン酸等のカルボン酸の塩又はグルタミン酸、アスパラギン酸等のアミノ酸の塩とすることができる。

或いは、本発明に包含される化合物のうちで、常法に従って金属塩にする

ことができるものは、例えば、リチウム、ナトリウム、カリウムといったアルカリ金属の塩、カルシウム、バリウム、マグネシウムといったアルカリ土類金属の塩又はアルミニウム、亜鉛、銅等の金属塩とすることができる。

[0040] 本発明に使用される一般式(1)で示される化合物或いはその製薬上許容され得る塩は製造条件により任意の結晶形として存在することができ、任意の水和物として存在することができるが、これら結晶形や水和物及びそれらの混合物も本発明の範囲に含有される。またアセトン、エタノール、テトラヒドロフランなどの有機溶媒を含む溶媒和物として存在することもあるが、これらの形態はいずれも本発明の範囲に含有される。

プロドラッグとして利用できる化合物は、加溶媒分解により又は生理的条件下のインビボにおいて本発明の薬理学的に活性な化合物を生成する、化学的又は代謝的に分解できる基を有する本発明の誘導体である。適当なプロドラッグを選択する方法及び製造する方法は、例えばDesign of Prodrugs (Elsevier, Amsterdam 1985)に記載されている。本発明において、水酸基を有する化合物である場合は、該化合物と適当なアシルハライド又は適当な酸無水物とを反応させることによって得られるアシルオキシ誘導体がプロドラッグとして例示される。プロドラッグとして特に好ましいアシルオキシとしては $-\text{OCOC}_2\text{H}_5$ 、 $-\text{OCO}(\text{t-Bu})$ 、 $-\text{OCOC}_{15}\text{H}_{31}$ 、 $-\text{OCO}(\text{m-CO}_2\text{Na-Ph})$ 、 $-\text{OCOCH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Na}$ 、 $-\text{OCOCH}(\text{NH}_2)\text{CH}_3$ 、 $-\text{OCOCH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$ などがあげられる。本発明を形成する化合物がアミノ基を有する場合は、アミノ基を有する化合物と適当な酸ハロゲン化物又は適当な混合酸無水物とを反応させることにより製造されるアミド誘導体がプロドラッグとして例示される。プロドラッグとして特に好ましいアミドとしては、 $-\text{NHCO}(\text{CH}_2)_{20}\text{OCH}_3$ 、 $-\text{NHCOCH}(\text{NH}_2)\text{CH}_3$ 等が挙げられる。

[0041] 次に、本明細書において示した各置換基の具体例を以下に示す。ここで、nはノルマル、i-はイソ、s-はセカンダリー及びt-はターシャリーを各々意味し、Phはフェニルを意味する。

本発明化合物におけるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭

素原子及びヨウ素原子が挙げられる。尚、本明細書中「ハロ」の表記もこれらのハロゲン原子を表す。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルキルの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、例えばメチル基、エチル基、*n*-プロピル基、*i*-プロピル基、*n*-ブチル基、*i*-ブチル基、*s*-ブチル基、*t*-ブチル基、*n*-ペンチル基、1-メチルブチル基、2-メチルブチル基、3-メチルブチル基、1-エチルプロピル基、1,1-ジメチルプロピル基、1,2-ジメチルプロピル基、2,2-ジメチルプロピル基、*n*-ヘキシル基、1-メチルペンチル基、2-メチルペンチル基、1,1-ジメチルブチル基、1,3-ジメチルブチル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基、デシル基、ウンデシル基、ドデシル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ ハロアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。例えばフルオロメチル基、クロロメチル基、ブromoメチル基、ヨードメチル基、ジフルオロメチル基、クロロフルオロメチル基、ジクロロメチル基、ブromoフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、ジクロロフルオロメチル基、トリクロロメチル基、ブromoジフルオロメチル基、ブromoクロロフルオロメチル基、ジフルオロヨードメチル基、2-フルオロエチル基、2-クロロエチル基、2-ブromoエチル基、2,2-ジフルオロエチル基、2-クロロ-2-フルオロエチル基、2,2-ジクロロエチル基、2-ブromo-2-フルオロエチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチル基、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチル基、2,2,2-トリクロロエチル基、2-ブromo-2,2-ジフルオロエチル基、1,1,2,2-テトラフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、1-クロロ-1,2,2,2-テトラフルオロエチル基、2-クロロ-1,1,2,2-テトラフルオロエチル基、1,2-ジクロロ-1,2,2-トリフルオロエチル基、1-ブromo-1,2,2,2-テトラフ

ルオロエチル基、2-ブromo-1,1,2,2-テトラフルオロエチル基、2-フルオロプロピル基、2-クロロプロピル基、2,3-ジクロロプロピル基、3,3,3-トリフルオロプロピル基、3-ブromo-3,3-ジフルオロプロピル基、2,2,3,3-テトラフルオロプロピル基、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロピル基、1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、2,3-ジクロロ-1,1,2,3,3-ペンタフルオロプロピル基、2-フルオロ-1-メチルエチル基、2-クロロ-1-メチルエチル基、2-ブromo-1-メチルエチル基、2,2,2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル基、ノナフルオロブチル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_\alpha \sim C_\beta$ シクロアルキルの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる環状の炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよい。例えばシクロプロピル基、1-メチルシクロプロピル基、2-メチルシクロプロピル基、2,2-ジメチルシクロプロピル基、2,2,3,3-テトラメチルシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、ビスクロ[2.2.1]ヘプタン-2-イル基、1-アダマンチル基、2-アダマンチル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0042] 本明細書における $C_\alpha \sim C_\beta$ ハロシクロアルキルの表記は、炭素原子に結合した水素原子が、ハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる環状の炭化水素基を表し、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよく、ハロゲン原子による置換は環構造部分であっても、側鎖部分であっても、或いはそれらの両方であってもよく、さらに、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっている場合

よい。例えば2-フルオロシクロプロピル基、2-クロロシクロプロピル基、2,2-ジフルオロシクロプロピル基、2,2-ジクロロシクロプロピル基、2,2-ジブロモシクロプロピル基、2,2-ジフルオロ-1-メチルシクロプロピル基、2,2-ジクロロ-1-メチルシクロプロピル基、2,2,3,3-テトラフルオロシクロブチル基、2-クロロ-2,3,3-トリフルオロシクロブチル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルケニルの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチルエテニル基、2-ブテニル基、1-メチル-2-プロペニル基、2-メチル-2-プロペニル基、2-ペンテニル基、2-メチル-2-ブテニル基、3-メチル-2-ブテニル基、2-エチル-2-プロペニル基、1,1-ジメチル-2-プロペニル基、2-ヘキセニル基、2-メチル-2-ペンテニル基、2,4-ジメチル-2,6-ヘプタジエニル基、3,7-ジメチル-2,6-オクタジエニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルキニルの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、例えばエチニル基、1-プロピニル基、2-プロピニル基、2-ブチニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-ペンチニル基、1-メチル-2-ブチニル基、1,1-ジメチル-2-プロピニル基、2-ヘキシニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルコキシの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-0-基を表し、例えばメトキシ基、エトキシ基、n-プロピルオキシ基、i-プロピルオキシ基、n-ブチルオキシ基、i-ブチルオキシ基、s-ブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、n-ペンチルオキシ基、n-ヘキシルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0043] 本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ ハロアルコキシの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個

よりなる前記の意味であるハロアルキル-0-基を表し、例えばジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、クロロジフルオロメトキシ基、ブロモジフルオロメトキシ基、2-フルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、2,2,2-トリフルオロエトキシ基、1,1,2,2,-テトラフルオロエトキシ基、2-クロロ-1,1,2-トリフルオロエトキシ基、2-ブromo-1,1,2-トリフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、2,2-ジクロロ-1,1,2-トリフルオロエトキシ基、2,2,2-トリクロロ-1,1-ジフルオロエトキシ基、2-ブromo-1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ基、2,2,3,3-テトラフルオロプロピルオキシ基、1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピルオキシ基、2,2,2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エトキシ基、ヘプタフルオロプロピルオキシ基、2-ブromo-1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルキルチオの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-S-基を表し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、i-プロピルチオ基、n-ブチルチオ基、i-ブチルチオ基、s-ブチルチオ基、t-ブチルチオ基、n-ペンチルチオ基、n-ヘキシルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ ハロアルキルチオの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-S-基を表し、例えばジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、クロロジフルオロメチルチオ基、ブロモジフルオロメチルチオ基、2,2,2-トリフルオロエチルチオ基、1,1,2,2-テトラフルオロエチルチオ基、2-クロロ-1,1,2-トリフルオロエチルチオ基、ペンタフルオロエチルチオ基、2-ブromo-1,1,2,2-テトラフルオロエチルチオ基、1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピルチオ基、ヘプタフルオロプロピルチオ基、1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチルチオ基、ノナフルオロブチルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0044] 本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルキルスルフィニルの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-S(0)-基を表し、例えばメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、*n*-プロピルスルフィニル基、*i*-プロピルスルフィニル基、*n*-ブチルスルフィニル基、*i*-ブチルスルフィニル基、*s*-ブチルスルフィニル基、*t*-ブチルスルフィニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ ハロアルキルスルフィニルの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-S(0)-基を表し、例えばジフルオロメチルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、クロロジフルオロメチルスルフィニル基、ブロモジフルオロメチルスルフィニル基、2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル基、2-ブロモ-1,1,2,2-テトラフルオロエチルスルフィニル基、1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチルスルフィニル基、ノナフルオロブチルスルフィニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルキルスルホニルの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-SO₂-基を表し、例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、*n*-プロピルスルホニル基、*i*-プロピルスルホニル基、*n*-ブチルスルホニル基、*i*-ブチルスルホニル基、*s*-ブチルスルホニル基、*t*-ブチルスルホニル基、*n*-ペンチルスルホニル基、*n*-ヘキシルスルホニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ ハロアルキルスルホニルの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-SO₂-基を表し、例えばジフルオロメチルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基、クロロジフルオロメチルスルホニル基、ブロモジフルオロメチルスルホニル基、2,2,2-トリフルオロエチルスルホニル基、1,1,2,2-テトラフルオロエチルスルホニル基、2-クロロ-1,1,2-トリフルオロエチルスルホニル基、2-ブロモ-1,1,2,2-テトラフルオロエチルスルホニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定

の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルキルアミノの表記は、水素原子の一方が炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたアミノ基を表し、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、*n*-プロピルアミノ基、*i*-プロピルアミノ基、*n*-ブチルアミノ基、*i*-ブチルアミノ基、*t*-ブチルアミノ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書におけるジ($C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルキル)アミノの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも又は互いに相異なってもよい炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたアミノ基を表し、例えばジメチルアミノ基、エチル(メチル)アミノ基、ジエチルアミノ基、*n*-プロピル(メチル)アミノ基、*i*-プロピル(メチル)アミノ基、ジ(*n*-プロピル)アミノ基、*n*-ブチル(メチル)アミノ基、*i*-ブチル(メチル)アミノ基、*t*-ブチル(メチル)アミノ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0045] 本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルキルイミノの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-N=基を表し、例えばメチルイミノ基、エチルイミノ基、*n*-プロピルイミノ基、*i*-プロピルイミノ基、*n*-ブチルイミノ基、*i*-ブチルイミノ基、*s*-ブチルイミノ基、*n*-ペンチルイミノ基、*n*-ヘキシルイミノ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルコキシイミノの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルコキシ-N=基を表し、例えばメトキシイミノ基、エトキシイミノ基、*n*-プロピルオキシイミノ基、*i*-プロピルオキシイミノ基、*n*-ブチルオキシイミノ基、*n*-ペンチルオキシイミノ基、*n*-ヘキシルオキシイミノ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルキルカルボニルの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim$

β 個よりなる前記の意味であるアルキル-C(0)-基を表し、例えばアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、バレリル基、イソバレリル基、2-メチルブタノイル基、ピバロイル基、ヘキサノイル基、ヘプタノイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ ハロアルキルカルボニルの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-C(0)-基を表し、例えばフルオロアセチル基、クロロアセチル基、ジフルオロアセチル基、ジクロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、クロロジフルオロアセチル基、ブロモジフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、ペンタフルオロプロピオニル基、ヘプタフルオロブタノイル基、3-クロロ-2,2-ジメチルプロパノイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルコキシカルボニルの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキル-O-C(0)-基を表し、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロピルオキシカルボニル基、i-プロピルオキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、i-ブトキシカルボニル基、t-ブトキシカルボニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0046] 本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ ハロアルコキシカルボニルの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル-O-C(0)-基を表し、例えば2-クロロエトキシカルボニル基、2,2-ジフルオロエトキシカルボニル基、2,2,2-トリフルオロエトキシカルボニル基、2,2,2-トリクロロエトキシカルボニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルキルアミノカルボニルの表記は、水素原子の一方が、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたカルバモイル基を表し、例えばメチルカルバモイル基、エチルカルバモイル基、n-プロピルカルバモイル基、i-プロピルカルバモイル基、n

-ブチルカルバモイル基、i-ブチルカルバモイル基、s-ブチルカルバモイル基、t-ブチルカルバモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ ハロアルキルアミノカルボニルの表記は、水素原子の一方が炭素原子数 $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル基によって置換されたカルバモイル基を表し、例えば2-フルオロエチルカルバモイル基、2-クロロエチルカルバモイル基、2,2-ジフルオロエチルカルバモイル基、2,2,2-トリフルオロエチルカルバモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書におけるジ($C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルキル)アミノカルボニルの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも又は互いに相異なってもよい炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたカルバモイル基を表し、例えばN,N-ジメチルカルバモイル基、N-エチル-N-メチルカルバモイル基、N,N-ジエチルカルバモイル基、N,N-ジ-n-プロピルカルバモイル基、N,N-ジ-n-ブチルカルバモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルキルアミノスルホニルの表記は、水素原子の一方が炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたスルファモイル基を表し、例えばメチルスルファモイル基、エチルスルファモイル基、n-プロピルスルファモイル基、i-プロピルスルファモイル基、n-ブチルスルファモイル基、i-ブチルスルファモイル基、s-ブチルスルファモイル基、t-ブチルスルファモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書におけるジ($C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルキル)アミノスルホニルの表記は、水素原子が両方とも、それぞれ同一でも又は互いに相異なってもよい炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたスルファモイル基を表し、例えばN,N-ジメチルスルファモイル基、N-エチル-N-メチルスルファモイル基、N,N-ジエチルスルファモイル基、N,N-ジ-n-プロピル

スルファモイル基、N,N-ジ-n-ブチルスルファモイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

[0047] 本明細書におけるトリ($C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルキル)シリルの表記は、それぞれ同一でも又は互いに相異なっているいてもよい炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基によって置換されたシリル基を表し、例えばトリメチルシリル基、トリエチルシリル基、トリ(n-プロピル)シリル基、エチルジメチルシリル基、n-プロピルジメチルシリル基、n-ブチルジメチルシリル基、i-ブチルジメチルシリル基、t-ブチルジメチルシリル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルキルスルホニルオキシの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキルスルホニル-0-基を表し、例えばメチルスルホニルオキシ基、エチルスルホニルオキシ基、n-プロピルスルホニルオキシ基、i-プロピルスルホニルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ ハロアルキルスルホニルオキシの表記は、炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキルスルホニル-0-基を表し、例えばジフルオロメチルスルホニルオキシ基、トリフルオロメチルスルホニルオキシ基、クロロジフルオロメチルスルホニルオキシ基、ブロモジフルオロメチルスルホニルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルコキシ($C_{\delta} \sim C_{\varepsilon}$)アルキルの表記は、それぞれ前記の意味である任意の $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルコキシ基、によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $\delta \sim \varepsilon$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書における $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルコキシ($C_{\delta} \sim C_{\varepsilon}$)アルコキシの表記は、それぞれ前記の意味である任意の $C_{\alpha} \sim C_{\beta}$ アルコキシ基によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $\delta \sim \varepsilon$ 個よりなる前記の意味であるアルコキシ基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

本明細書におけるハロゲン原子によって任意に置換された($C_\alpha \sim C_\beta$)アルケニル又は R^{31} によって任意に置換された($C_\alpha \sim C_\beta$)アルケニルの表記は、任意のハロゲン原子又は R^{31} によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキニル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。このとき、それぞれの($C_\alpha \sim C_\beta$)アルケニル基上のハロゲン原子又は置換基 R^{31} が2個以上存在するとき、それぞれの R^{31} 又はハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっているもよい。

[0048] 本明細書におけるハロゲン原子によって任意に置換された($C_\alpha \sim C_\beta$)アルキニル又は R^{31} によって任意に置換された($C_\alpha \sim C_\beta$)アルキニルの表記は、任意のハロゲン原子又は R^{31} によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキニル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。このとき、それぞれの($C_\alpha \sim C_\beta$)アルキニル基上のハロゲン原子又は置換基 R^{31} が2個以上存在するとき、それぞれの R^{31} 又はハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっているもよい。

本明細書におけるベンゼン環上が e 個の R^{21} で任意に置換されたベンジル、ベンゼン環上が f 個の R^{22} で置換されていても良いベンジル又はベンゼン環上が g 個の R^{15} で置換されていてもよいベンジルの表記は、任意の R^{21} 、 R^{22} 又は R^{15} によって、ベンゼン環上の炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が e 、 f 、又は g 個よりなる前記の意味であるベンジル基を表す。このとき、それぞれのベンゼン環上の置換基 R^{21} 、 R^{22} 又は R^{15} が2個以上存在するとき、それぞれの置換基 R^{21} 、 R^{22} 又は R^{15} は互いに同一でも、又は互いに相異なっているもよい。

本明細書における e 個の R^{21} で任意に置換されたフェニル、 f 個の R^{22} で置換されていても良いフェニル、 k 個の R^{81} で任意に置換されたフェニルの表記は、任意の R^{21} 、 R^{22} 又は R^{81} によって、ベンゼン環上の炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が e 、 f 、又は k 個よりなる前記の意味である

フェニル基を表す。このとき、それぞれのベンゼン環上の置換基 R^{21} 、 R^{22} 又は R^{81} が2個以上存在するとき、それぞれの置換基 R^{21} 、 R^{22} 又は R^{81} は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

本明細書におけるベンゼン環上が b 個の R^{14} で任意に置換されていても良い1-フェネチルの表記は、任意の R^{14} によって、ベンゼン環上の炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が b 個よりなる前記の意味である1-フェネチル基を表す。このとき、それぞれのベンゼン環上の置換基 R^{14} が2個以上存在するとき、それぞれの置換基 R^{14} は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

本明細書におけるベンゼン環上が b 個の R^{14} で任意に置換されていても良い2-フェネチルの表記は、任意の R^{14} によって、ベンゼン環上の炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が b 個よりなる前記の意味である2-フェネチル基を表す。このとき、それぞれのベンゼン環上の置換基 R^{14} が2個以上存在するとき、それぞれの置換基 R^{14} は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

本明細書における R^{17} で置換された($C_{\alpha} \sim C_{\beta}$)アルキルの表記は、 R^{17} によって、炭素原子に結合した水素原子が任意に置換された炭素原子数が $\alpha \sim \beta$ 個よりなる前記の意味であるアルキル基を表し、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。このとき、それぞれの($C_{\alpha} \sim C_{\beta}$)アルキル基上の置換基 R^{17} が2個以上存在するとき、それぞれの R^{17} は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

[0049] 本発明に包含される化合物において、 R^1 で表される置換基の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

すなわち、 R^1 -I : $C_1 \sim C_6$ アルキル。

R^1 -II : $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{17} で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、フェニル及び a 個の R^{11} によって置換されたフェニル[ここで R^{11} はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_1 \sim C_6$ アルコキシを表し、 a が2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相

異なってもよく、 R^{12} は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、 R^{17} は $-C(O)OR^{12}$ 又はフェニルを表し、 a は1～5の整数を表す。]。

R^1 -III : $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{17} で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、D5、フェニル及び a 個の R^{11} によって置換されたフェニル[ここで R^{11} はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ又はニトロを表し、 a が2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに2つの R^{11} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{11} は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{11} のそれぞれが結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、 R^2 はハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、 R^{12} は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、 R^{17} は $-C(O)OR^{12}$ 又はフェニルを表し、 a は1～5の整数を表し、 s_2 は0～3の整数を表す。]。

R^1 -IV : $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{17} で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、D2、D4、D5、D7、D21、D22、D23、フェニル及び a 個の R^{11} によって置換されたフェニル[ここで R^{11} はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルコキシ、ニトロ又はフェニルを表し、 R^{12} は水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表し、 a が2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに2つの R^{11} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{11} は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{11} のそれぞれが結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 R^{12} は水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表し、 R^{17} は $-C(O)OR^{12}$ 又はフェニルを表し、 Z はハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、 R^v は $C_1 \sim C_6$ アルキル又はフェニルを表し、 R^z はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェノキシ、フェニル又は m 個の R^{16} で置換されていても良いフェニルを表し、 R^{16} はハロゲン原子、 $C_1 \sim C$

C_6 アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシを表し、 m が2以上の整数を表すとき、各々の R^{16} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、 s_2 又は s_3 が2以上の整数を表すとき、各々の R^2 は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、 a は1～5の整数を表し、 m は1～5の整数を表し、 s_2 は0～3の整数を表し、 s_3 は0～2の整数を表す。]。

本発明に包含される化合物において、 R^2 で表される置換基の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

R^2 -I：水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェニル及び e 個の R^{21} で任意に置換されたフェニル[ここで R^{21} はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ ($C_1 \sim C_2$) アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又はフェニルを表し、 e が2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、 e は1～5の整数を表す。]。

R^2 -II：水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 D_2 、ベンジル、ベンゼン環上が e 個の R^{21} で任意に置換されたベンジル、フェニル及び e 個の R^{21} で任意に置換されたフェニル[ここで R^{21} はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ ($C_1 \sim C_2$) アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、ニトロ、シアノ又はフェニルを表し、 e が2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、さらに2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、 Z はハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、 R^2 はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェノキシ又はフェニルを表し、 s_2 が2以上の整数を表すとき、各々の R^2 は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、 e は1～5の整数を表し、 s_2 は0～3の整数を表す。]。

R²-III : 水素原子、C₁~C₆アルキル、D2、D7、ベンジル、ベンゼン環上がe個のR²¹で任意に置換されたベンジル、フェニル及びe個のR²¹で任意に置換されたフェニル[ここでR²¹はハロゲン原子、C₁~C₁₀アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₁₀アルコキシ、C₁~C₆アルコキシ (C₁~C₆) アルコキシ、C₁~C₁₀ハロアルキル、C₁~C₁₀ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、フェノキシ、フェニル又はf個のR²²で置換されていても良いフェニルを表し、fが2以上の整数を表すとき、各々のR²²は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、eが2以上の整数を表すとき、各々のR²¹は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つのR²¹が隣接する場合には、隣接する2つのR²¹は-OCH₂O-, -OCH₂CH₂O-, -OCH=CH-又は-CH=CHCH=CH-を形成することにより、2つのR²¹のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、R²²はハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルキル又はC₁~C₆ハロアルコキシを表し、Zはハロゲン原子又はC₁~C₆アルキルを表し、fが2以上の整数を表すとき、各々のR²²は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、R^zはハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、フェノキシ、フェニル又はm個のR¹⁶で置換されていても良いフェニルを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々のR¹⁶は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、s₂が2以上の整数を表すとき、各々のR_zは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、R¹⁶はハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルキル又はC₁~C₆ハロアルコキシを表し、eは1~5の整数を表し、fは1~5の整数を表し、mは1~5の整数を表し、s₂は0~3の整数を表す。]。

[0050] R²-IV : 水素原子、C₁~C₆アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、D2、D7、ベンジル、ベンゼン環上がe個のR²¹で任意に置換されたベンジル、フェニル及びe個のR²¹で任意に置換されたフェニル[ここでR²¹はハロゲン原子、C₁~C₁₀アルキル、C₃

$\sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、フェノキシ、フェニル又はf個の R^{22} で置換されていても良いフェニルを表し、fが2以上の整数を表すとき、各々の R^{22} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、eが2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 R^{22} はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシを表し、Zはハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、 R^z はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェノキシ、フェニル又はm個の R^{16} で置換されていても良いフェニルを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々の R^{16} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、s2が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 R^{16} はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシを表し、eは1～5の整数を表し、fは1～5の整数を表し、mは1～5の整数を表し、s2は0～3の整数を表す。]。

[0051] 本発明に包含される化合物において、 R^3 で表される置換基の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

R^3 -I：水素原子。

R^3 -II：水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 及び $-C(O)N(R^{12})R^{13}$ [ここで R^{12} 、 R^{13} はそれぞれ独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表す。]、 $-Si(R^{32})(R^{33})R^{34}$ [ここで R^{32} 、 R^{33} 、 R^{34} はそれぞれ独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル

又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表す。]。

R^3 -III : 水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 及び $-C(O)N(R^{12})R^{13}$ [ここで R^{12} , R^{13} はそれぞれ独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表す。]、 $-Si(R^{32})(R^{33})R^{34}$ [ここで R^{32} , R^{33} , R^{34} はそれぞれ独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表す。]、ベンジル又はベンゼン環上が g 個の R^{15} で置換されていてもよいベンジル[ここで R^{15} はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルを表し、 g が2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 g は1～5の整数を表す。]。

本発明に包含される化合物において、 R^4 で表される置換基の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

R^4 -I : $C_1 \sim C_4$ アルキル。

本発明に包含される化合物において、 R^5 で表される置換基の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

R^5 -I : $C_1 \sim C_4$ アルキル。

本発明に包含される化合物において、 R^4 と R^5 で表される置換基の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

R^4+R^5 : $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 又は $-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2-$ を形成することにより R^4 と R^5 がそれぞれ結合する炭素原子と共に3員環、4員環、5員環又は6員環を形成する。

本発明に包含される化合物において、 R^8 で表される置換基の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

R^8 -I : F1、フェニル、1-ナフチル又は2-ナフチル。

R^8 -II : D2、F1、フェニル及び k 個の R^{81} で任意に置換されたフェニル[ここで R^{81} はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、フェニル又はフェノキシを表し、 k が2以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに2つの R^{81} が隣接

する場合は、隣接する2つの R^{81} は $-OCH_2O-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 R^z はハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、フェノキシ又はフェニルを表し、s2が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、kは1～5の整数を表し、s2は0～3の整数を表す。]

R^8 -III : D2、F1、フェニル及びk個の R^{81} で任意に置換されたフェニル[ここで R^{81} はハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルコキシ、 $C_1\sim C_2$ アルコキシ ($C_1\sim C_2$) アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルキル、フェニル又はフェノキシを表し、kが2以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに2つの R^{81} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{81} は $-OCH_2O-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 R^z はハロゲン原子又は $C_1\sim C_6$ アルキル、フェノキシ、フェニル又はm個の R^{16} で置換されていても良いフェニルを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々の R^{16} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、s2が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 R^{16} はハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシを表し、kは1～5の整数を表し、mは1～5の整数を表し、s2は0～3の整数を表す。]。

[0052] R^8 -IV : D2、D7、D23、F1、F2、フェニル及びk個の R^{81} で任意に置換されたフェ

ニル[ここで R^{81} はハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルコキシ、 $C_1\sim C_2$ アルコキシ ($C_1\sim C_2$) アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルキル、フェニル又はフェノキシを表し、 k が2以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つの R^{81} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{81} は $-OCH_2O-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 R^2 はハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、フェノキシ、フェニル又は m 個の R^{16} で置換されていても良いフェニルを表し、 m が2以上の整数を表すとき、各々の R^{16} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 s_2 が2以上の整数を表すとき、各々の R_z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 R^{16} はハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシを表し、 k は1～5の整数を表し、 m は1～5の整数を表し、 s_2 は0～3の整数を表す。]。

本発明に包含される化合物において、 X で表される置換基の範囲として、例えば下記の各群が挙げられる。

X-1：単結合。

X-2： $-CH_2-$ 。

これらの本発明に包含される化合物における各置換基の範囲を示す各群は、それぞれ任意に組み合わせることができそれぞれ本発明化合物の範囲を表す。 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^8 及び X についての範囲の組み合わせの例としては、例えば、以下の第1表に示す組み合わせが挙げられる。但し、第1表の組み合わせは例示のためのものであって、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

[0053] 第 1 表

第 1 表 (続き)

R ¹	R ²	R ³	R ⁸	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁸	X
R ¹ -I	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -I	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -I	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -I	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -I	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -I	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -I	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -I	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -I	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -I	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -I	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -I	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -I	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -I	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -I	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -I	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -I	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -I	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -I	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -I	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -I	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -I	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -I	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -I	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -I	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -I	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -I	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -I	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -I	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -I	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -I	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -I	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -I	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -I	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -I	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -I	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -I	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -I	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -I	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -I	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -I	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -I	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -I	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -I	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -I	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -I	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -I	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -I	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2

R ¹ -I	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -I	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -I	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -I	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -I	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -I	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -I	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -I	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -I	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -I	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -I	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -I	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -I	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -I	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -I	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -I	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -I	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -I	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -I	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -I	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -I	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -I	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -I	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -I	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2

[0054] 第1表 (続き)

第1表 (続き)

R ¹	R ²	R ³	R ⁸	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁸	X
R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -I	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2

R ¹ -II	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -II	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -II	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -II	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -II	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -II	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -II	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -II	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -II	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -II	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -II	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -II	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -II	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -II	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -II	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -II	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -II	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -II	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -II	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -II	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -II	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -II	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -II	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -II	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -II	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -II	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -II	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -II	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -II	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -II	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -II	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -II	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -II	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -II	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -II	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -II	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -II	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -II	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -II	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -II	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -II	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -II	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -II	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -II	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -II	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -II	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -II	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -II	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -II	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -II	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -II	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -II	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -II	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -II	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -II	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -II	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2

R ¹ -II	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -II	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -II	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -II	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -II	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -II	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -II	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -II	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -II	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -II	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -II	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -II	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -II	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -II	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -II	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -II	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2

[0055] 第 1 表 (続き)

第 1 表 (続き)

R ¹	R ²	R ³	R ⁸	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁸	X
R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -II	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -III	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -III	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -III	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -III	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -III	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -III	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -III	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -III	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2

R ¹ -III	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -III	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -III	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -III	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -III	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -III	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -III	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -III	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -III	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -III	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -III	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -III	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -III	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -III	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -III	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -III	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -III	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -III	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -III	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -III	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -III	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -III	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -III	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -III	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -III	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -III	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -III	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -III	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -III	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -III	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -III	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -III	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -III	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -III	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -III	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -III	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -III	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -III	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -III	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -III	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -III	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -III	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -III	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -III	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -III	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -III	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -III	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -III	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -III	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -III	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -III	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -III	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -III	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -III	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -III	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -III	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2

R ¹ -III	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -III	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -III	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -III	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -III	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -III	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -III	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -III	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2

[0056] 第 1 表 (続き)

第 1 表 (続き)

R ¹	R ²	R ³	R ⁸	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁸	X
R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -III	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2

R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -IV	R ² -I	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -IV	R ² -II	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1	R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1	R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1	R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1	R ¹ -IV	R ² -III	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2

[0057] 第 1 表 (続き)

R ¹	R ²	R ³	R ⁸	X
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -I	X-1
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -II	X-1
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -III	X-1
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-1
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -I	X-1
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -II	X-1
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -III	X-1
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-1
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -I	X-1
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -II	X-1
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -III	X-1
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-1

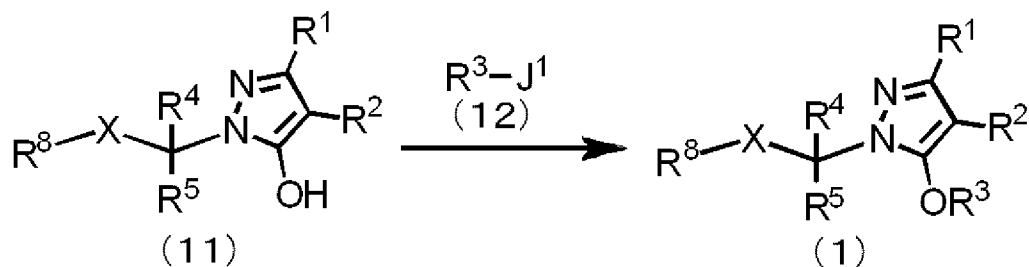
第 1 表 (続き)

R ¹	R ²	R ³	R ⁸	X
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -I	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -II	R ⁸ -IV	X-2
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -I	X-2
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -II	X-2
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -III	X-2
R ¹ -IV	R ² -IV	R ³ -III	R ⁸ -IV	X-2

本発明化合物は、例えば以下の方法により製造することが出来る。

製造法A

[0058] [化8]



[0059] 一般式 (11) [式中R¹, R², R⁴, R⁵, R⁸及びXは前記と同じ意味を表す。]と一般式 (12) [式中R³は前記と同じ意味を表し、J¹は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、ハロスルホニルオキシ基 (例えば、フルオロスルホニルオキシ基)]

、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルオキシ基（例えば、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基）又はアリールスルホニルオキシ基（例えば、ベンゼンスルホニルオキシ基）等を表す。］を必要ならば塩基の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて反応させることにより、一般式（１）〔式中 $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^8$ 及び X は前記と同じ意味を表す。〕で表される本発明化合物を得ることができる。

反応基質の量は、一般式（１１）で表される化合物１当量に対して１～５０当量の一般式（１２）で表される化合物を用いることができる。

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば特に制限はないが、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、１,２-ジクロロエタン、１,１,１-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、１,２-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、１,４-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、 N -メチル-２-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、 N, N -ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、１,３-ジメチル-２-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの２種類以上を混合して用いてもよい。

塩基を用いる場合、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、ナトリウムエトキシド、カリウム t -ブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムヘキサメチルジシラザン、ナトリウムアミド等のアルカリ金属アミド類、 t -ブチルリチウム等の

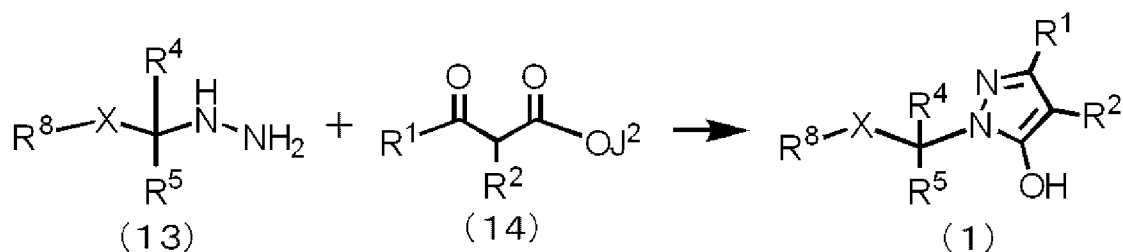
有機金属化合物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、イミダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン等の有機塩基等を、一般式(11)で表される化合物1当量に対して1~10当量用いることができる。

反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

一般的には、例えば一般式(11)で表される化合物1当量に対して1~10当量の一般式(12)で表される化合物を用い、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、クロロホルム、塩化メチレンやトルエン等の溶媒中、必要ならば塩基として水素化ナトリウム、カリウムt-ブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、トリエチルアミンやピリジン等を一般式(11)で表される化合物1当量に対して1~3当量用いて、0~100℃の温度範囲で、10分から24時間反応を行なうのが好ましい。

製造法B

[0060] [化9]



一般式(13)[式中R⁴, R⁵, R⁸及びXは前記と同じ意味を表す。]と一般式(14)[式中R¹及びR²は前記と同じ意味を表し、J²はメチル基、エチル基などのアルキル基を表す。]を必要ならば酸の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて、文献記載の公知の方法、例えば国際特許出願公報(WO 2005/061462号公報)等に記載の方法で反応させることにより、一般式(1)[式中R¹, R², R⁴, R⁵, R⁸, 及びXは前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物

を得ることができる。

反応基質の量は、一般式（１４）で表される化合物１当量に対して１～５０当量の一般式（１３）で表される化合物を用いることができる。

[0061] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば特に制限はないが、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、１,２-ジクロロエタン、１,１,１-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、１,２-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、１,４-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、Ｎ-メチル-２-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、Ｎ,Ｎ-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、１,３-ジメチル-２-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの２種類以上を混合して用いてもよい。

酸を用いる場合、塩酸、硫酸などの鉱酸、あるいはギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、マンデル酸、酒石酸などのカルボン酸類、あるいはメタンスルホン酸、ｐ-トルエンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、カンファースルホン酸などのスルホン酸類、オキシ塩化リン、Ambertlite IR-120(H型)等を、一般式（１４）で表される化合物１当量に対して１～１０当量用いることができる。

反応温度は－６０℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常５分から１００時間の範囲で任意に設定できる。

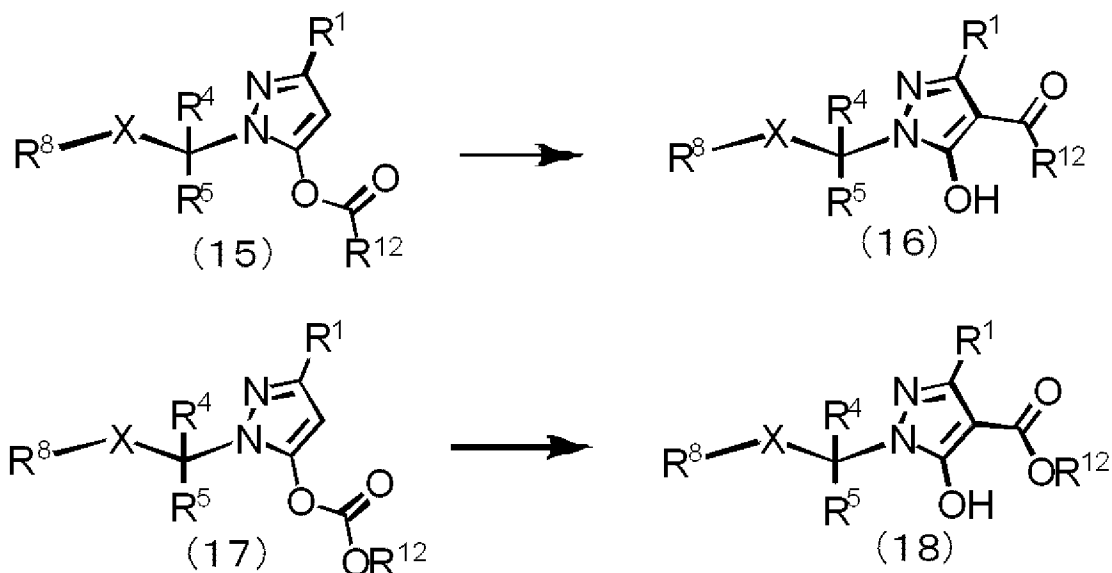
一般的には、例えば一般式（１４）で表される化合物１当量に対して１～

10当量の一般式(13)で表される化合物を用い、エタノール、トルエン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、アセトニトリル、N、N-ジメチルホルムアミド、クロロホルムや塩化メチレン等の溶媒中、必要ならば酸として酢酸、p-トルエンスルホン酸や塩酸等を一般式(14)で表される化合物1当量に対して1~3当量用いて、0~100℃の温度範囲で、10分から24時間反応を行なうのが好ましい。

ここで用いられる一般式(14)で表されるケトエステル化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の公知の方法、例えば日本国特許出願公報(JP2002-020366号公報)、J. Med. Chem.、2005年、48巻、3400頁等に記載の方法に準じて、公知化合物から容易に合成することが出来る。

製造法C

[0062] [化10]



[0063] 製造法Aに準じて合成できる一般式(15)及び一般式(17)[式中R¹, R⁴, R⁵, R⁸, R¹²及びXは前記と同じ意味を表す。]を、必要ならば塩基の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて、文献記載の公知の方法、例えば国際特許出願公報(WO2007/142308号公報)等に記載の方法で反応させることにより、一般式(16)及び一般式(18)[式中R¹, R⁴, R⁵, R⁸, R¹²及びXは前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物を得ることができる。

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば特に制限はないが、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

塩基を用いる場合、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムヘキサメチルジシラン、ナトリウムアミド等のアルカリ金属アミド類、t-ブチルリチウム等の有機金属化合物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、イミダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン等の有機塩基等を、一般式(15)及び一般式(17)で表される化合物1当量に対して1~10当量用いることができる。

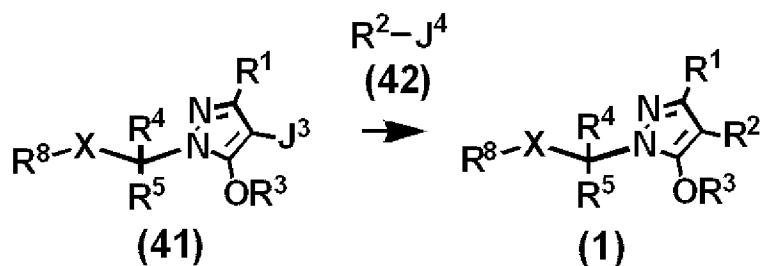
反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが

、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

[0064] 一般的には、例えば一般式(15)及び一般式(17)で表される化合物1当量を用い、エタノール、トルエン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、アセトニトリル、N、N-ジメチルホルムアミド、クロロホルムや塩化メチレン等の溶媒中、必要ならば塩基として水素化ナトリウム、カリウムt-ブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、トリエチルアミンやピリジン等を一般式(15)及び一般式(17)で表される化合物1当量に対して1～3当量用いて、0～100℃の温度範囲で、10分から24時間反応を行なうのが好ましい。

製造法D

[0065] [化11]



一般式(41) [式中 $\text{R}^1, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^8$, 及び X は前記と同じ意味を表し、 J^3 は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等を表す。] と一般式(42) [式中 R^2 は前記と同じ意味を表し、 J^4 はジヒドロキシボラン等を表す。] を必要ならば金属触媒の存在下、必要ならば塩基の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて、文献記載の公知の方法、例えば国際特許出願公報(WO 2010/07944 32号公報)等に記載の方法で反応させることにより、一般式(1) [式中 $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^8$ 及び X は前記と同じ意味を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

反応基質の量は、一般式(41)で表される化合物1当量に対して1～50当量の一般式(42)で表される化合物を用いることができる。

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば特に制限はないが、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香

族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

塩基を用いる場合、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムヘキサメチルジシラン、ナトリウムアミド等のアルカリ金属アミド類、t-ブチルリチウム等の有機金属化合物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、イミダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン等の有機塩基等を、一般式(41)及び一般式(42)で表される化合物1当量に対して1~10当量用いることができる。

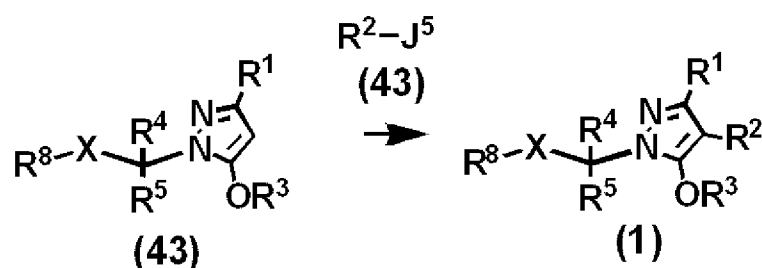
金属触媒を用いる場合、具体例としては、例えば $\text{Pd}(\text{OH})_2$ 等の水酸化パラジウム触媒、例えばPd0等の酸化パラジウム触媒、例えば PdBr_2 、 PdCl_2 、 PdI_2 等のハロゲン化パラジウム触媒、例えばパラジウムアセテート($\text{Pd}(\text{OAc})_2$)、パラジウムトリフルオロアセテート($\text{Pd}(\text{OCOCF}_3)_2$)等のパラジウム酢酸塩触

媒、例えばPd(RNC)₂Cl₂, Pd(acac)₂, ジアセテートビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム [Pd(OAc)₂(PPh₃)₂], Pd(PPh₃)₄, Pd₂(dba)₃, Pd(NH₃)₂Cl₂, Pd(CH₃CN)₂Cl₂, ジクロロビス（ベンゾニトリル）パラジウム [Pd(PhCN)₂Cl₂], Pd(dppe)Cl₂, Pd(dppf)Cl₂, Pd[PCy₃]₂Cl₂, Pd(PPh₃)₂Cl₂, Pd[P(o-tolyl)₃]₂Cl₂, Pd(cod)₂Cl₂, Pd(PPh₃)(CH₃CN)₂Cl₂、Bis(di-tert-butyl (4-dimethylaminophenyl)phosphine)dichloropalladium(II)等の配位子に配位されたパラジウム金属錯体触媒等が挙げられる。

これらの金属触媒を、一般式（41）及び一般式（42）で表される化合物 1 当量に対して 1 ～ 10 当量用いることができる。0.01 ～ 10 当量用いることができる。

製造法E

[0066] [化12]



一般式（43）〔式中R¹, R³, R⁴, R⁵, R⁸, 及びXは前記と同じ意味を表す。〕と一般式（44）〔式中R²は前記と同じ意味を表し、J⁵は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等を表す。〕を必要ならば塩基の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて、文献記載の公知の方法、例えばBioorganic & Medicinal Chemistry、2006年、14巻、5061頁等に記載の方法で反応させることにより、一般式（1）〔式中R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁸及びXは前記と同じ意味を表す。〕で表される本発明化合物を得ることができる。

反応基質の量は、一般式（43）で表される化合物 1 当量に対して 1 ～ 50 当量の一般式（44）で表される化合物を用いることができる。

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば特に制限はないが、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香

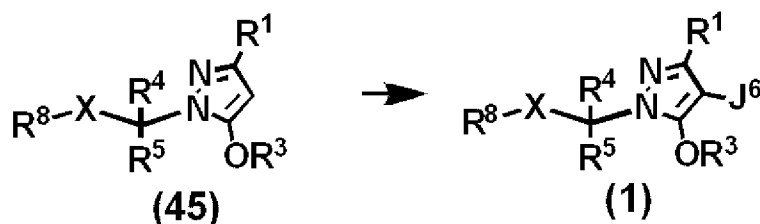
族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

塩基を用いる場合、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等のアルカリ金属水酸化物、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムヘキサメチルジシラザン、ナトリウムアミド等のアルカリ金属アミド類、t-ブチルリチウム等の有機金属化合物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、イミダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン等の有機塩基等を、一般式(43)及び一般式(44)で表される化合物1当量に対して1～10当量用いることができる。

製造法F

[0067]

[化13]



一般式 (45) [式中 $\text{R}^1, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^8$, 及び X は前記と同じ意味を表す。] を必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて、文献記載の公知の方法、例えばBioorganic & Medicinal Chemistry、2006年、14巻、5061頁等に記載の方法で反応させることにより、一般式 (1) [式中 $\text{R}^1, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^8$, 及び X は前記と同じ意味を表し、 J^6 は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等を表す。] で表される本発明化合物を得ることができる。

ハロゲン化試薬としてはN-ブロモスクシンイミド、N-クロロスクシンイミド、塩素、臭素、ヨウ化カリウム、ヨウ化ナトリウム等を用いることができる。

反応基質の量は、一般式 (45) で表される化合物1当量に対して1～50当量のハロゲン化試薬を用いることができる。

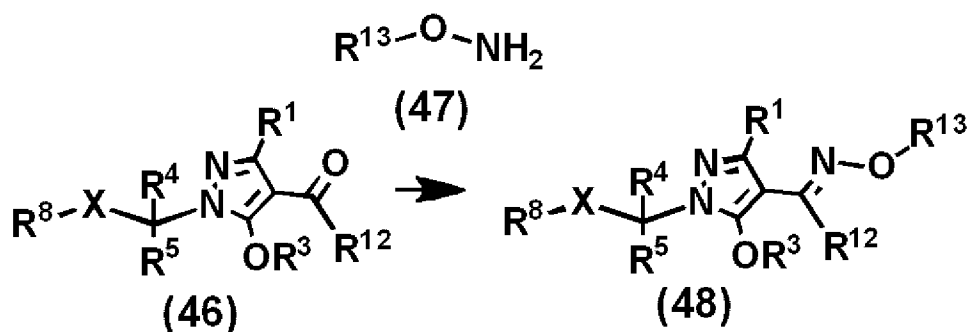
溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば特に制限はないが、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等の

アルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。

反応温度は−60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

製造法G

[0068] [化14]



一般式(46) [式中 $R^1, R^3, R^4, R^5, R^8, R^{12}$, 及び X は前記と同じ意味を表す。]と一般式(47) [式中 R^{13} は前記と同じ意味を表す。]を、必要ならば塩基の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて、文献記載の公知の方法、例えばEuropean Journal of Organic Chemistry、2003年、7巻、1209頁やOrganic Letters、2008年、10巻、1695頁等に記載の方法で反応させることにより、一般式(48) [式中 $R^1, R^3, R^4, R^5, R^8, R^{12}, R^{13}$, 及び X は前記と同じ意味を表す。]で表される本発明化合物を得ることができる。

反応基質の量は、一般式(46)で表される化合物1当量に対して1～50当量の一般式(47)で表される化合物を用いることができる。

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば特に制限はないが、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジク

ロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。

塩基を用いる場合、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、酢酸ナトリウム等のアルカリ金属水酸化物、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムヘキサメチルジシラザン、ナトリウムアミド等のアルカリ金属アミド類、t-ブチルリチウム等の有機金属化合物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、イミダゾール、1,8-ジアザビスクロ[5,4,0]-7-ウンデセン等の有機塩基等を、一般式(46)及び一般式(47)で表される化合物1当量に対して1~10当量用いることができる。

反応温度は-60℃から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常5分から100時間の範囲で任意に設定できる。

一般的には、例えば一般式(46)及び一般式(47)で表される化合物1当量を用い、エタノール、トルエン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、クロロホルムや塩化メチレン等の溶媒中、必要ならば塩基として水素化ナトリウム、カリウムt-ブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、酢酸ナトリウム、トリエチルア

ミンやピリジン等を一般式（４６）及び一般式（４７）で表される化合物１当量に対して１～３当量用いて、０～１００℃の温度範囲で、１０分から２４時間反応を行なうのが好ましい。

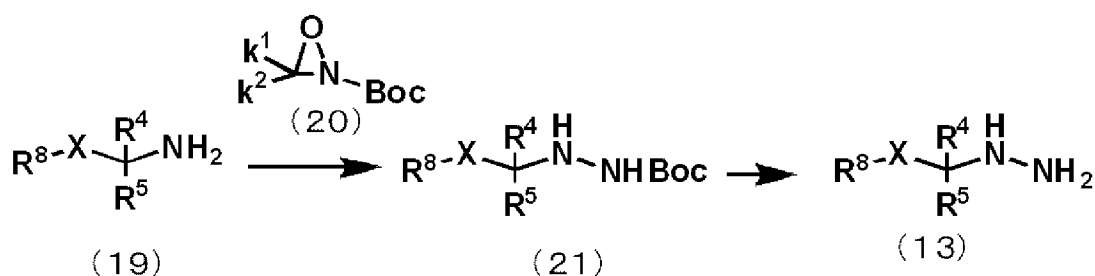
ここで用いられる一般式（４７）で表されるアミン化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の公知の方法、例えばJ. Am. Chem. Soc、２０１１年、１３３巻、８７０４頁等に記載の方法に準じて、公知化合物から容易に合成することが出来る。

[0069] 製造法Ａ、Ｂ、Ｃ、Ｄ、Ｅ、Ｆ及びＧにおいて、反応終了後の反応混合物は、直接濃縮する、有機溶媒に溶解し、水洗後濃縮する、又は氷水に投入、有機溶媒抽出後濃縮といった通常の後処理を行ない、目的の本発明化合物を得ることができる。また、精製の必要が生じたときには、再結晶、カラムクロマトグラフ、薄層クロマトグラフ、液体クロマトグラフ分取等の任意の精製方法によって分離、精製することができる。

製造法Ｂで用いられる一般式（１３）で表される化合物は、例えば次のようにして合成することができる。

反応式１

[0070] [化15]



すなわち、一般式（１９）〔式中 R^4 、 R^5 、 R^8 及び X は前記と同じ意味を表す。〕で表される公知の置換アミンと一般式（２０）〔式中 k^1 及び k^2 は水素原子、トリクロロメチル基、シクロヘキシル基、フェニル基、 p -シアノフェニル基、エトキシカルボニル基などを表し、Bocは t -ブトキシカルボニル基を表す。〕を、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて、文献記載の公知の方法

、例えばテトラヘドロンレターズ (Tetrahedron Lett., 1989年、39号、6845頁) 等に記載の方法で反応させることにより、一般式(13) [式中 R^4 , R^5 , R^8 及び X は前記と同じ意味を表す。] で表される化合物を得ることができる。

[0071] 溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば特に制限はないが、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、*N*-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、*N,N*-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

ここで用いられる一般式(19)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載の公知の方法、例えばJournal of Medicinal Chemistry, 2009年、52巻、3982頁、Chem. Commun., 2001年、1792頁、Synthesis 2000年、12巻、1709頁等に記載の方法に準じて容易に合成することができる。

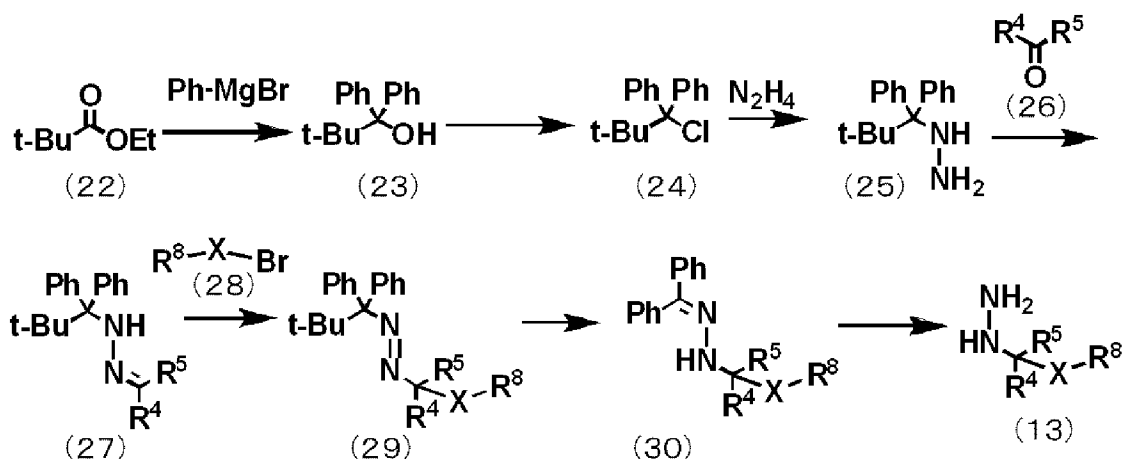
またここで用いられる一般式(20)で表される化合物は、Journal of Medicinal Chemistry, 2009年、52巻、1471頁 [52(5), 1471-1476; 2009]、国際特許出願公報 (W02008/073987号公報) 等に記載の方法に準じて、

公知化合物から容易に合成することができる。

あるいは製造法Bで用いられる一般式(13)は、J. Chem. Soc., Chem. Commun., 1986年、176頁、J. Chem. Soc., Chem. Commun., 1983年、1040頁等に記載の方法に準じて、例えば次のように合成することができる。

反応式2

[0072] [化16]



[0073] すなわち、一般式(22)で表されるピバル酸エチルエステルに一般式で表されるフェニルグリニャール試薬を、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて反応させることにより、一般式(23)で表されるアルコール化合物とした後、ハロゲン化して一般式(24)で表されるハライド化合物とし、ヒドラジンと反応させることにより、一般式(25)で表されるヒドラジン化合物を得ることが出来る。

ここで得られた一般式(25)で表されるヒドラジン化合物と一般式(26)で表されるカルボニル化合物を、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて、反応させることにより、一般式(27)で表されるヒドラジン化合物とした後、一般式(28)で表されるハライド化合物を、必要ならば塩基の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて、反応させることにより、一般式(29)で表されるヒドラジン化合物とし、酸の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて、反応させることによ

り、一般式(30)で表されるヒドラジン化合物を得ることが出来る。

ここで得られた一般式(30)で表されるヒドラジン化合物を酸の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて、反応させることにより、一般式(13)で表されるヒドラジン化合物を得ることが出来る。

溶媒を用いる場合、用いられる溶媒としては反応の進行を阻害しないものであれば特に制限はないが、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン、ヘプタン等の脂肪族炭化水素類、シクロヘキサン等の脂環式炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等の芳香族ハロゲン化炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,1-トリクロロエタン、トリクロロエチレン、テトラクロロエチレン等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、ジエチルエーテル、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、プロピオン酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン等のアミド類、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン等のアミン類、ピリジン、ピコリン等のピリジン類、メタノール、エタノール、エチレングリコール等のアルコール類、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、スルホラン、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及び水等が挙げられる。これらの溶媒は単独で用いても、これらのうちの2種類以上を混合して用いてもよい。

[0074] 塩基を用いる場合、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属水素化物、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシド等のアルカリ金属アルコキシド類、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムヘキサメチルジシラザン、ナトリウムアミド等のアルカリ金属アミド類、t-ブチルリチウム等の有機金属化合物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等のアルカリ金属炭酸塩、トリエチルアミン、トリブチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、ピリジン、4-(ジメチルアミノ)ピリジン、イミダゾール、1,8-ジアザビシクロ[5,4,0]-7-ウンデセン等の有機塩基等を、一般式(27)で表

される化合物 1 当量に対して 1 ～ 10 当量用いることができる。

酸を用いる場合、塩酸、硫酸などの鉱酸、あるいはギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、マンデル酸、酒石酸などのカルボン酸類、あるいはメタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、カンファースルホン酸などのスルホン酸類、オキシ塩化リン、Ambertlite IR-120(H型)等を、一般式(29)及び一般式(30)で表される化合物 1 当量に対して 1 ～ 10 当量用いることができる。

反応温度は -60℃ から反応混合物の還流温度までの任意の温度を設定することができ、反応時間は、反応基質の濃度、反応温度によって変化するが、通常 5 分から 100 時間の範囲で任意に設定できる。

ここで用いられる一般式(22)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載のエステル化合物類の一般的な合成方法に準じて合成することができる。

また、ここで用いられる一般式(26)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載のカルボニル化合物類の一般的な合成方法に準じて合成することができる。

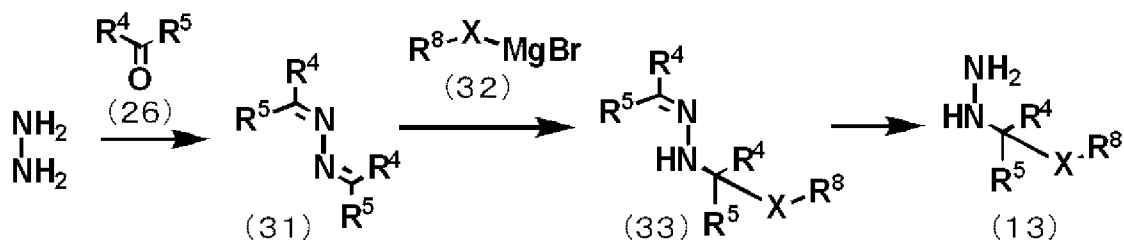
また、ここで用いられる一般式(28)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載のハライド化合物類の一般的な合成方法に準じて合成することができる。

あるいは製造法Bで用いられる一般式(12)は、J. Am. Chem. Soc., 1958年、80巻、6562頁等に記載の方法に準じて、例えば次のように合成することができる。

反応式 3

[0075]

[化17]



[0076] すなわち、ヒドラジンと一般式(26)で表されるカルボニル化合物を、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて反応させることにより、一般式(31)で表されるヒドラジン化合物とした後、一般式(32)で表されるグリニャール試薬と反応させることにより、一般式(33)で表されるヒドラジン化合物を得ることが出来る。

ここで得られた一般式(33)で表されるヒドラジン化合物を酸の存在下、必要ならば該反応に対して不活性な溶媒を用いて、反応させることにより、一般式(13)で表されるヒドラジン化合物を得ることが出来る。

ここで用いられる一般式(26)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載のカルボニル化合物類の一般的な合成方法に準じて合成することができる。

また、ここで用いられる一般式(32)で表される化合物の或るものは公知化合物であり、一部は市販品として入手できる。また、それ以外のものも文献記載のグリニャール試薬類の一般的な合成方法に準じて合成することができる。

これらの各反応においては、反応終了後、通常の後処理を行なうことにより原料化合物となる各々の製造中間体を得ることができる。

[0077] また、これらの方法により製造された各々の製造中間体は、単離・精製することなく、それぞれそのまま次工程の反応に用いることもできる。

本発明に包含される化合物としては、具体的に例えば、第2表～第15表に示す化合物が挙げられる。但し、第2表～第15表の化合物は例示のためのものであって、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

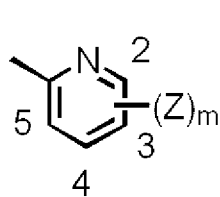
尚、表中Etとの記載はエチル基を表し、以下同様にn-Pr及びPr-nはノルマ

ルプロピル基を、i-Pr及びPr-iはイソプロピル基を、c-Pr及びPr-cはシクロプロピル基を、n-Bu及びBu-nはノルマルブチル基を、s-Bu及びBu-sはセカンダリーブチル基を、i-Bu及びBu-iはイソブチル基を、t-Bu及びBu-tはt-ブチル基を、c-Bu及びBu-cはシクロブチル基を、n-Pen及びPen-nはノルマルペンチル基を、c-Pen及びPen-cはシクロペンチル基を、n-Hex及びHex-nはノルマルヘキシル基を、c-Hex及びHex-cはシクロヘキシル基を、Phはフェニル基をそれぞれ表す。

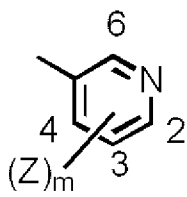
表中A001～A044で表される芳香族複素環は、それぞれ下記の構造を表し、

[0078]

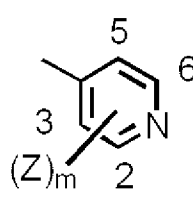
[化18]



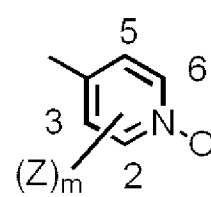
A001



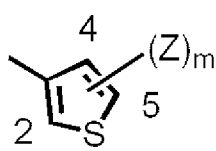
A002



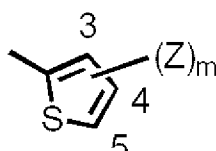
A003



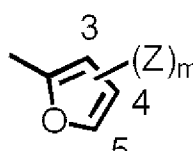
A004



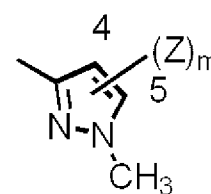
A005



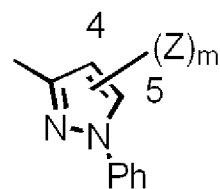
A006



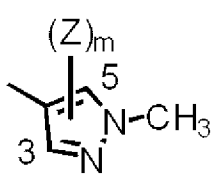
A007



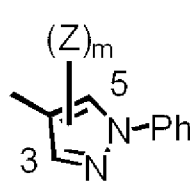
A008



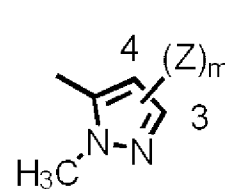
A009



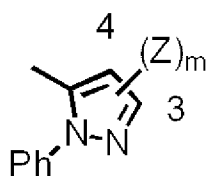
A010



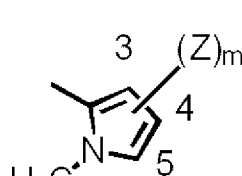
A011



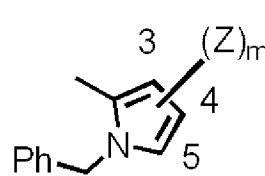
A012



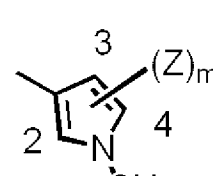
A013



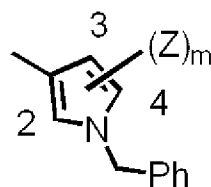
A014



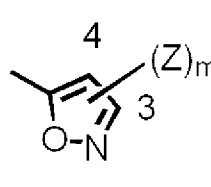
A015



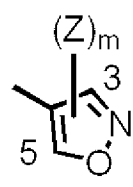
A016



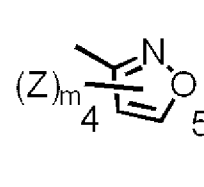
A017



A018



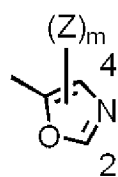
A019



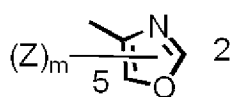
A020

[0079]

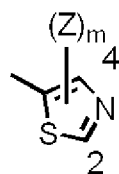
[化19]



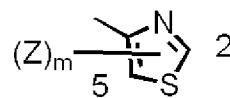
A021



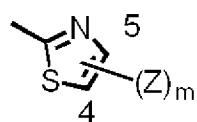
A022



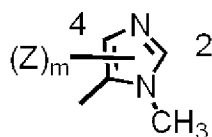
A023



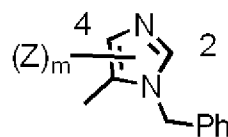
A024



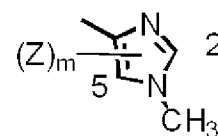
A025



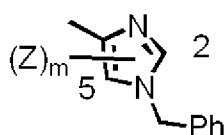
A026



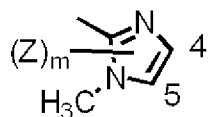
A027



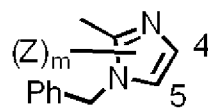
A028



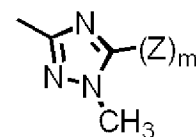
A029



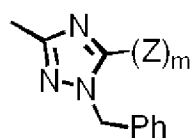
A030



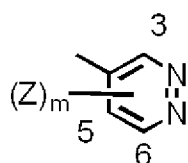
A031



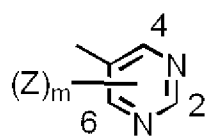
A032



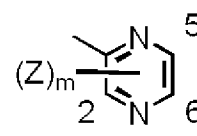
A033



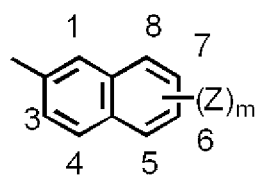
A034



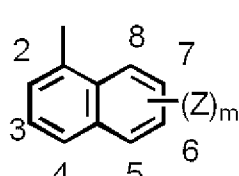
A035



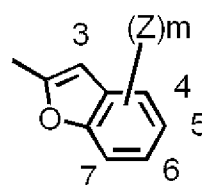
A036



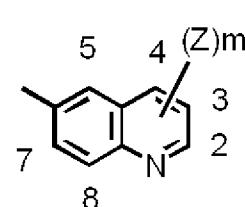
A037



A038



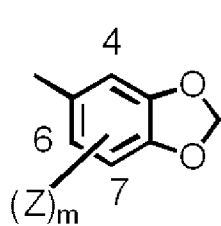
A039



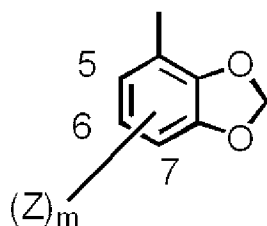
A040

[0080]

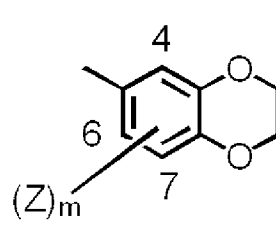
[化20]



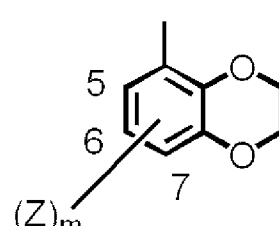
A041



A042



A043



A044

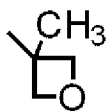
また、表中A051～A068で表される脂肪族複素環は、下記の構造を表し、

[0081]

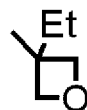
[化21]



A051



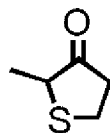
A052



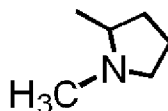
A053



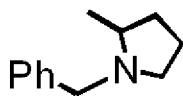
A054



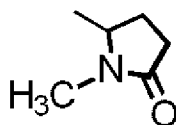
A055



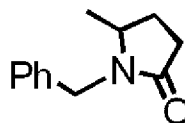
A056



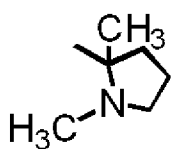
A057



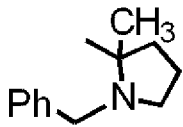
A058



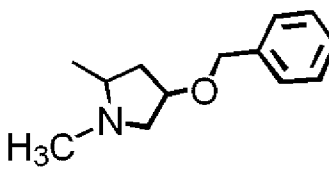
A059



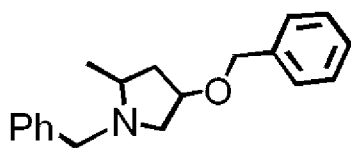
A060



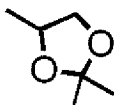
A061



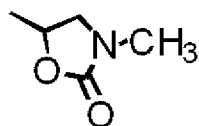
A062



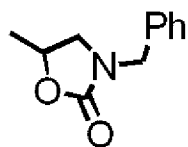
A063



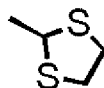
A064



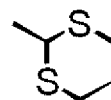
A065



A066



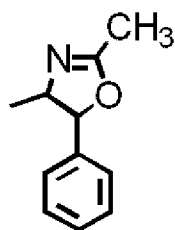
A067



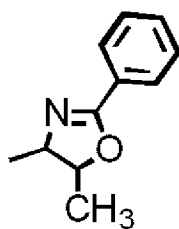
A068

さらに、表中A101～A107で表される部分飽和複素環は、それぞれ下記の構造を表す。

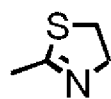
[0082] [化22]



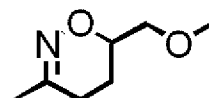
A101



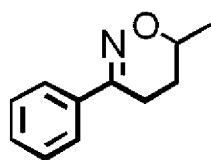
A102



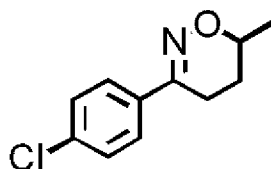
A103



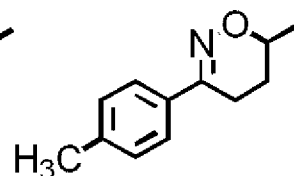
A104



A105



A106



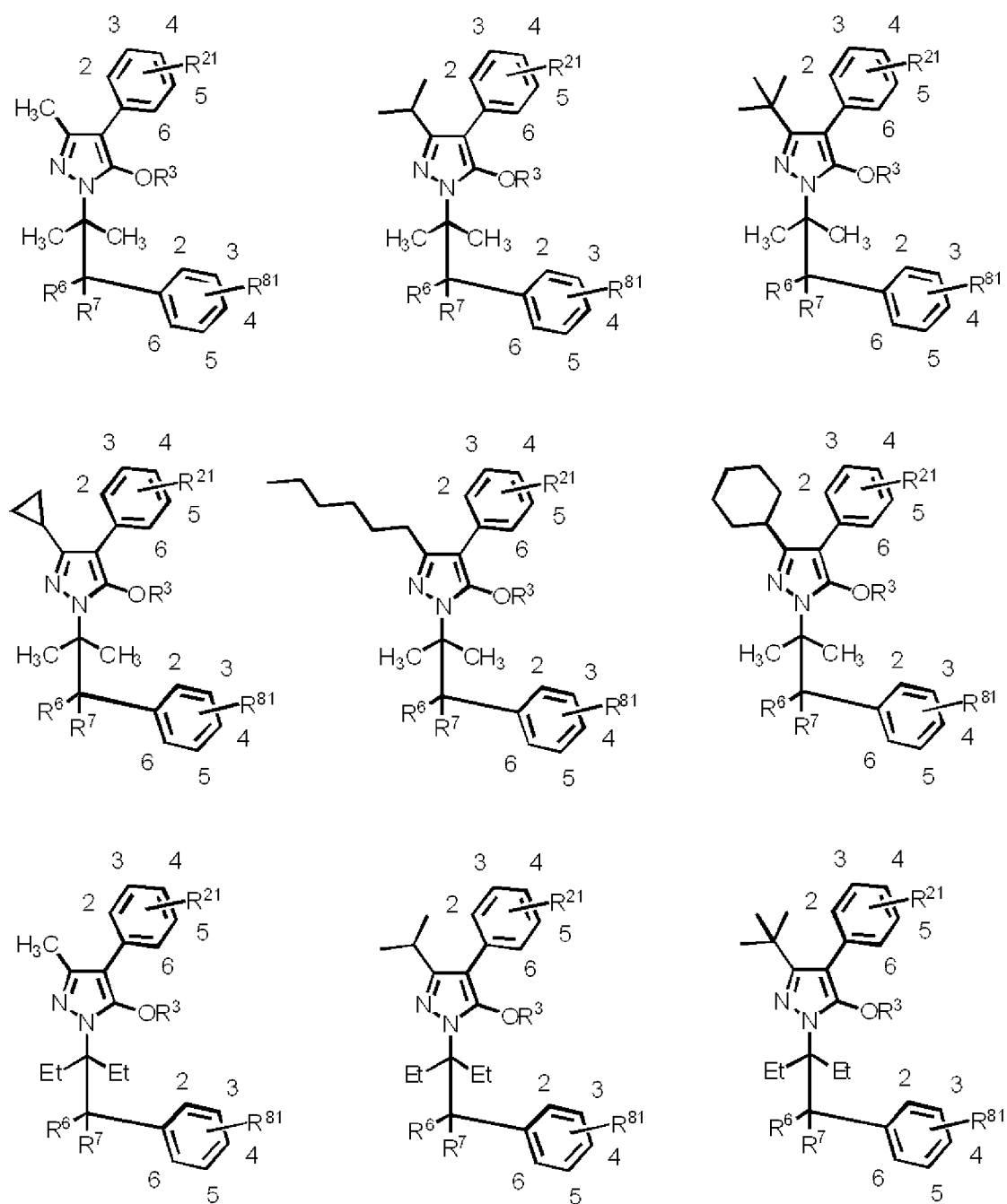
A107

[0083] 第2表

表中、置換基 R^{21} 及び R^{81} の置換位置を表す番号は、それぞれ下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものである。

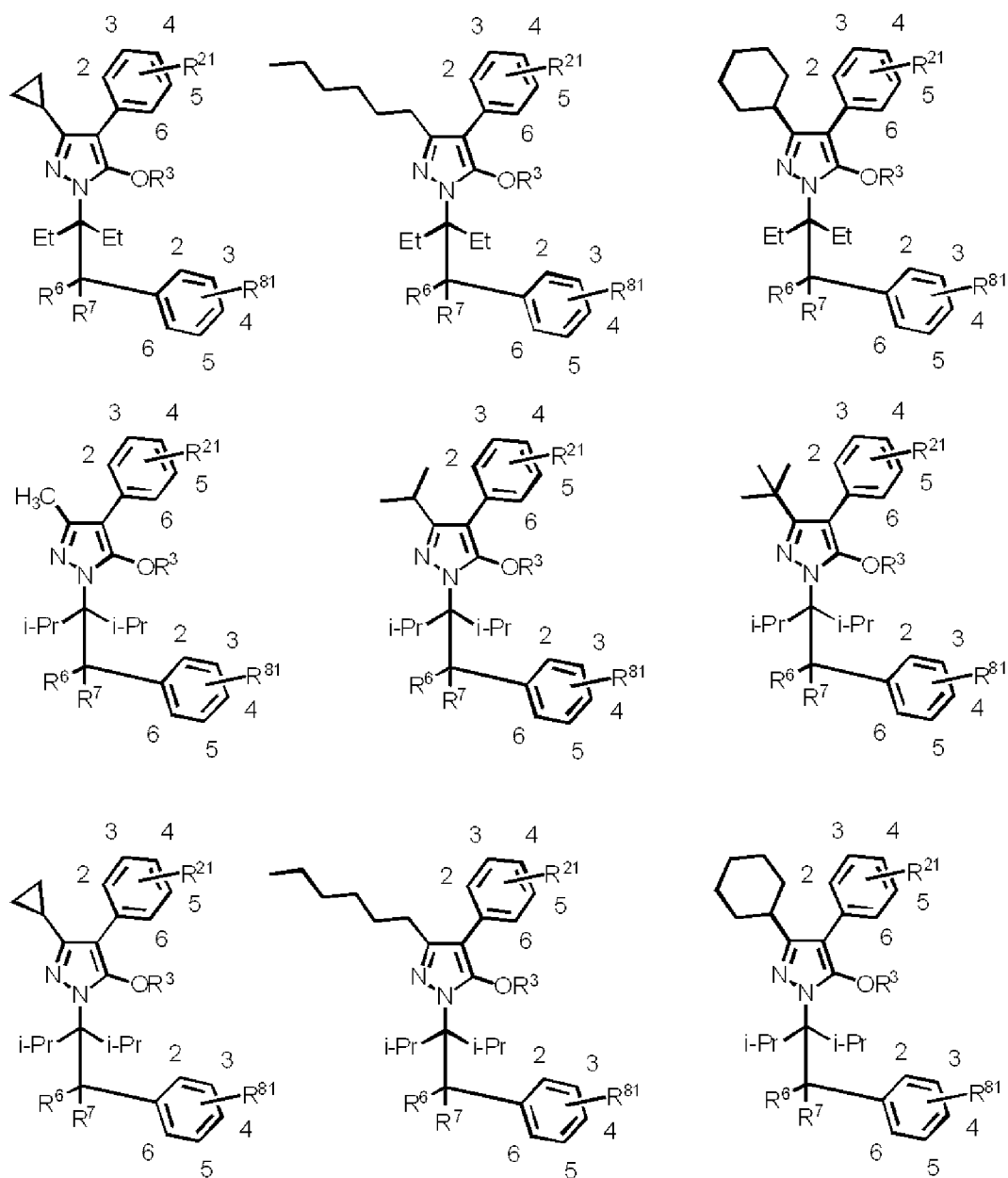
[0084]

[化23]



[0085]

[化24]



[0086]

H	4-Cl	CH ₃	H	CH ₃
H	4-Cl	H	CH ₃	CH ₃
H	4-Br	H	H	H
H	4-I	H	H	H
H	2,4-Cl ₂	H	H	H
H	3,4-Cl ₂	H	H	H
H	4-NO ₂	H	H	H
H	4-CN	H	H	H
H	2-CH ₃	H	H	H
H	3-CH ₃	H	H	H
H	4-CH ₃	H	H	H
H	4-CH ₃	CH ₃	H	H
H	4-CH ₃	CH ₂ Ph	H	H
H	4-CH ₃	C(O)Ph	H	H
H	4-CH ₃	C(O)OEt	H	H
H	4-CH ₃	H	H	CH ₃
H	4-CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
H	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
H	4-Et	H	H	H
H	4-n-Pr	H	H	H
H	4-c-Pr	H	H	H
H	4-i-Pr	H	H	H
H	4-n-Bu	H	H	H
H	4-c-Bu	H	H	H
H	4-i-Bu	H	H	H
H	4-t-Bu	H	H	H
H	4-t-Bu	CH ₃	H	H
H	4-t-Bu	CH ₂ Ph	H	H

H	4-t-Bu	C(0)Ph	H	H
H	4-t-Bu	C(0)OEt	H	H
H	4-t-Bu	H	H	CH ₃
H	4-t-Bu	CH ₃	H	CH ₃
H	4-t-Bu	H	CH ₃	CH ₃
H	4-n-Pen	H	H	H
H	4-c-Pen	H	H	H
H	4-n-Hex	H	H	H

[0088] 第2表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
H	4-n-Hex	CH ₃	H	H
H	4-n-Hex	CH ₂ Ph	H	H
H	4-n-Hex	C(0)Ph	H	H
H	4-n-Hex	C(0)OEt	H	H
H	4-n-Hex	H	H	CH ₃
H	4-n-Hex	CH ₃	H	CH ₃
H	4-n-Hex	H	CH ₃	CH ₃
H	4-c-Hex	H	H	H
H	4-n-C ₇ H ₁₅	H	H	H
H	4-n-C ₈ H ₁₇	H	H	H
H	4-n-C ₉ H ₁₉	H	H	H
H	4-n-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H
H	2,4-(CH ₃)	H	H	H
H	3,4-(CH ₃) ₂	H	H	H
H	4-CF ₃	H	H	H
H	4-OH	H	H	H

H	2-OCH ₃	H	H	H
H	3-OCH ₃	H	H	H
H	4-OCH ₃	H	H	H
H	4-O-n-Hex	H	H	H
H	4-O-c-Hex	H	H	H
H	2, 4-(OCH ₃) ₂	H	H	H
H	3, 4-(OCH ₃) ₂	H	H	H
H	4-OCH ₂ OCH ₃	H	H	H
H	4-OC ₂ H ₄ OEt	H	H	H
H	4-OCF ₃	H	H	H
H	4-OPh	H	H	H
H	4-OCH ₂ Ph	H	H	H
H	4-C(CH ₃)=NCH ₃	H	H	H
H	4-C(CH ₃)=NPh	H	H	H
H	4-C(Ph)=NCH ₃	H	H	H
H	4-C(Ph)=NPh	H	H	H
H	4-C(CH ₃)=NOCH ₃	H	H	H
H	4-C(CH ₃)=NOPh	H	H	H
H	4-C(Ph)=NOCH ₃	H	H	H
H	4-C(Ph)=NOPh	H	H	H
H	4-C(O)CH ₃	H	H	H
H	4-C(O)CF ₃	H	H	H
H	4-C(O)Ph	H	H	H
H	4-C(O)OCH ₃	H	H	H
H	2-C(O)OEt	H	H	H
H	3-C(O)OEt	H	H	H
H	4-C(O)OEt	H	H	H
H	4-C(O)OPh	H	H	H

H 4-C(0)OCH₂Ph H H H

[0089] 第2表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
H	4-C(0)OCH(CH ₃)Ph	H	H	H
H	4-C(0)OC ₂ H ₄ Ph	H	H	H
H	4-SCH ₃	H	H	H
H	4-S(0)CH ₃	H	H	H
H	4-S(0) ₂ CH ₃	H	H	H
H	4-SPh	H	H	H
H	4-S(0)Ph	H	H	H
H	4-S(0) ₂ Ph	H	H	H
H	4-OS(0) ₂ CH ₃	H	H	H
H	4-OS(0) ₂ Ph	H	H	H
H	4-N(CH ₃) ₂	H	H	H
H	4-N(CH ₂ Ph) ₂	H	H	H
H	4-N(CH ₃)(CH ₂ Ph)	H	H	H
H	4-NHCH ₃	H	H	H
H	4-NH(CH ₂ Ph)	H	H	H
H	4-C(0)N(CH ₃) ₂	H	H	H
H	4-C(0)N(CH ₂ Ph) ₂	H	H	H
H	4-C(0)N(CH ₃)(CH ₂ Ph)	H	H	H
H	4-C(0)NHCH ₃	H	H	H
H	4-C(0)NH(CH ₂ Ph)	H	H	H
H	4-C(0)NH(CH(CH ₃)Ph)	H	H	H
H	4-C(0)NH(C ₂ H ₄ Ph)	H	H	H
H	4-C(S)NH ₂	H	H	H

H	4-S(O) ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	H
H	4-S(O) ₂ N(CH ₂ Ph) ₂	H	H	H
H	4-S(O) ₂ N(CH ₃)(CH ₂ Ph)	H	H	H
H	4-S(O) ₂ NHCH ₃	H	H	H
H	4-S(O) ₂ NHPh	H	H	H
H	4-S(O) ₂ NH(CH ₂ Ph)	H	H	H
H	4-S(O) ₂ NH{CH(CH ₃)Ph}	H	H	H
H	4-S(O) ₂ NH(C ₂ H ₄ Ph)	H	H	H
H	4-Ph	H	H	H
H	4-Ph	CH ₃	H	H
H	4-Ph	CH ₂ Ph	H	H
H	4-Ph	C(O)Ph	H	H
H	4-Ph	C(O)OEt	H	H
H	4-Ph	H	H	CH ₃
H	4-Ph	CH ₃	H	CH ₃
H	4-Ph	H	CH ₃	CH ₃
4-F	H	H	H	H
4-F	4-Cl	H	H	H
4-F	4-Br	H	H	H
4-F	4-CH ₃	H	H	H
4-F	4-t-Bu	H	H	H
4-F	4-n-Hex	H	H	H

[0090] 第2表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
4-F	4-Ph	H	H	H
2-Cl	H	H	H	H

2-Cl	4-Cl	H	H	H
2-Cl	4-Br	H	H	H
2-Cl	4-CH ₃	H	H	H
2-Cl	4-t-Bu	H	H	H
2-Cl	4-n-Hex	H	H	H
2-Cl	4-Ph	H	H	H
3-Cl	H	H	H	H
3-Cl	4-Cl	H	H	H
3-Cl	4-Br	H	H	H
3-Cl	4-CH ₃	H	H	H
3-Cl	4-t-Bu	H	H	H
3-Cl	4-n-Hex	H	H	H
3-Cl	4-Ph	H	H	H
4-Cl	H	H	H	H
4-Cl	4-Cl	H	H	H
4-Cl	4-Br	H	H	H
4-Cl	4-CH ₃	H	H	H
4-Cl	4-t-Bu	H	H	H
4-Cl	4-t-Bu	CH ₃	H	H
4-Cl	4-n-Hex	H	H	H
4-Cl	4-n-Hex	CH ₃	H	H
4-Cl	4-n-Hex	H	H	CH ₃
4-Cl	4-n-Hex	H	CH ₃	CH ₃
4-Cl	4-Ph	H	H	H
4-Cl	4-Ph	CH ₃	H	H
4-Br	H	H	H	H
4-Br	4-Cl	H	H	H
4-Br	4-Br	H	H	H

4-Br	4-CH ₃	H	H	H
4-Br	4-t-Bu	H	H	H
4-Br	4-n-Hex	H	H	H
4-Br	4-Ph	H	H	H
3,4-Cl ₂	H	H	H	H
3,4-Cl ₂	4-Cl	H	H	H
3,4-Cl ₂	4-Br	H	H	H
3,4-Cl ₂	4-CH ₃	H	H	H
3,4-Cl ₂	4-t-Bu	H	H	H
3,4-Cl ₂	4-n-Hex	H	H	H
3,4-Cl ₂	4-Ph	H	H	H
4-NO ₂	H	H	H	H
4-NO ₂	4-Cl	H	H	H
4-NO ₂	4-Br	H	H	H
4-NO ₂	4-CH ₃	H	H	H

[0091] 第2表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
4-NO ₂	4-t-Bu	H	H	H
4-NO ₂	4-n-Hex	H	H	H
4-NO ₂	4-Ph	H	H	H
4-CN	H	H	H	H
4-CN	4-Cl	H	H	H
4-CN	4-Br	H	H	H
4-CN	4-CH ₃	H	H	H
4-CN	4-t-Bu	H	H	H
4-CN	4-n-Hex	H	H	H

4-CN	4-Ph	H	H	H
2-CH ₃	H	H	H	H
2-CH ₃	4-Cl	H	H	H
2-CH ₃	4-Br	H	H	H
2-CH ₃	4-CH ₃	H	H	H
2-CH ₃	4-t-Bu	H	H	H
2-CH ₃	4-n-Hex	H	H	H
2-CH ₃	4-Ph	H	H	H
3-CH ₃	H	H	H	H
3-CH ₃	4-Cl	H	H	H
3-CH ₃	4-Br	H	H	H
3-CH ₃	4-CH ₃	H	H	H
3-CH ₃	4-t-Bu	H	H	H
3-CH ₃	4-n-Hex	H	H	H
3-CH ₃	4-Ph	H	H	H
4-CH ₃	H	H	H	H
4-CH ₃	4-Cl	H	H	H
4-CH ₃	4-Br	H	H	H
4-CH ₃	4-CH ₃	H	H	H
4-CH ₃	4-t-Bu	H	H	H
4-CH ₃	4-t-Bu	CH ₃	H	H
4-CH ₃	4-n-Hex	H	H	H
4-CH ₃	4-n-Hex	CH ₃	H	H
4-CH ₃	4-n-Hex	H	H	CH ₃
4-CH ₃	4-n-Hex	H	CH ₃	CH ₃
4-CH ₃	4-Ph	H	H	H
4-CH ₃	4-Ph	CH ₃	H	H
4-c-Pr	H	H	H	H

4-c-Pr	4-Cl	H	H	H
4-c-Pr	4-Br	H	H	H
4-c-Pr	4-CH ₃	H	H	H
4-c-Pr	4-t-Bu	H	H	H
4-c-Pr	4-n-Hex	H	H	H
4-c-Pr	4-Ph	H	H	H
4-i-Pr	H	H	H	H
4-i-Pr	4-Cl	H	H	H

[0092] 第2表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
4-i-Pr	4-Br	H	H	H
4-i-Pr	4-CH ₃	H	H	H
4-i-Pr	4-t-Bu	H	H	H
4-i-Pr	4-n-Hex	H	H	H
4-i-Pr	4-Ph	H	H	H
4-t-Bu	H	H	H	H
4-t-Bu	4-Cl	H	H	H
4-t-Bu	4-Br	H	H	H
4-t-Bu	4-CH ₃	H	H	H
4-t-Bu	4-t-Bu	H	H	H
4-t-Bu	4-t-Bu	CH ₃	H	H
4-t-Bu	4-n-Hex	H	H	H
4-t-Bu	4-n-Hex	CH ₃	H	H
4-t-Bu	4-n-Hex	H	H	CH ₃
4-t-Bu	4-n-Hex	H	CH ₃	CH ₃
4-t-Bu	4-Ph	H	H	H

4-t-Bu	4-Ph	CH ₃	H	H
4-n-Hex	H	H	H	H
4-n-Hex	H	CH ₃	H	H
4-n-Hex	H	CH ₂ Ph	H	H
4-n-Hex	H	C(O)Ph	H	H
4-n-Hex	H	C(O)OEt	H	H
4-n-Hex	H	H	H	CH ₃
4-n-Hex	H	CH ₃	H	CH ₃
4-n-Hex	H	H	CH ₃	CH ₃
4-n-Hex	4-F	H	H	H
4-n-Hex	2-Cl	H	H	H
4-n-Hex	3-Cl	H	H	H
4-n-Hex	4-Cl	H	H	H
4-n-Hex	4-Cl	CH ₃	H	H
4-n-Hex	4-Cl	CH ₂ Ph	H	H
4-n-Hex	4-Cl	C(O)Ph	H	H
4-n-Hex	4-Cl	C(O)OEt	H	H
4-n-Hex	4-Cl	H	H	CH ₃
4-n-Hex	4-Cl	CH ₃	H	CH ₃
4-n-Hex	4-Cl	H	CH ₃	CH ₃
4-n-Hex	4-Br	H	H	H
4-n-Hex	4-I	H	H	H
4-n-Hex	2,4-Cl ₂	H	H	H
4-n-Hex	3,4-Cl ₂	H	H	H
4-n-Hex	4-NO ₂	H	H	H
4-n-Hex	4-CN	H	H	H
4-n-Hex	2-CH ₃	H	H	H
4-n-Hex	3-CH ₃	H	H	H

4-n-Hex 4-CH₃ H H H

[0093] 第2表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
4-n-Hex	4-CH ₃	CH ₃	H	H
4-n-Hex	4-CH ₃	CH ₂ Ph	H	H
4-n-Hex	4-CH ₃	C(O)Ph	H	H
4-n-Hex	4-CH ₃	C(O)OEt	H	H
4-n-Hex	4-CH ₃	H	H	CH ₃
4-n-Hex	4-CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
4-n-Hex	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
4-n-Hex	4-Et	H	H	H
4-n-Hex	4-n-Pr	H	H	H
4-n-Hex	4-c-Pr	H	H	H
4-n-Hex	4-i-Pr	H	H	H
4-n-Hex	4-n-Bu	H	H	H
4-n-Hex	4-c-Bu	H	H	H
4-n-Hex	4-i-Bu	H	H	H
4-n-Hex	4-t-Bu	H	H	H
4-n-Hex	4-t-Bu	CH ₃	H	H
4-n-Hex	4-t-Bu	CH ₂ Ph	H	H
4-n-Hex	4-t-Bu	C(O)Ph	H	H
4-n-Hex	4-t-Bu	C(O)OEt	H	H
4-n-Hex	4-t-Bu	H	H	CH ₃
4-n-Hex	4-t-Bu	CH ₃	H	CH ₃
4-n-Hex	4-t-Bu	H	CH ₃	CH ₃
4-n-Hex	4-n-Pen	H	H	H

4-n-Hex	4-c-Pen	H	H	H
4-n-Hex	4-n-Hex	H	H	H
4-n-Hex	4-n-Hex	CH ₃	H	H
4-n-Hex	4-n-Hex	CH ₂ Ph	H	H
4-n-Hex	4-n-Hex	C(=O)Ph	H	H
4-n-Hex	4-n-Hex	C(=O)OEt	H	H
4-n-Hex	4-n-Hex	H	H	CH ₃
4-n-Hex	4-n-Hex	CH ₃	H	CH ₃
4-n-Hex	4-n-Hex	H	CH ₃	CH ₃
4-n-Hex	4-c-Hex	H	H	H
4-n-Hex	4-n-C ₇ H ₁₅	H	H	H
4-n-Hex	4-n-C ₈ H ₁₇	H	H	H
4-n-Hex	4-n-C ₉ H ₁₉	H	H	H
4-n-Hex	4-n-C ₁₀ H ₂₁	H	H	H
4-n-Hex	2, 4-(CH ₃)	H	H	H
4-n-Hex	3, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
4-n-Hex	4-CF ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-OH	H	H	H
4-n-Hex	2-OCH ₃	H	H	H
4-n-Hex	3-OCH ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-OCH ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-O-n-Hex	H	H	H

[0094] 第2表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
4-n-Hex	4-O-c-Hex	H	H	H
4-n-Hex	2, 4-(OCH ₃) ₂	H	H	H

4-n-Hex	3, 4-(OCH ₃) ₂	H	H	H
4-n-Hex	4-OCH ₂ OCH ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-OC ₂ H ₄ OEt	H	H	H
4-n-Hex	4-OCF ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-OPh	H	H	H
4-n-Hex	4-OCH ₂ Ph	H	H	H
4-n-Hex	4-C(CH ₃)=NCH ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-C(CH ₃)=NPh	H	H	H
4-n-Hex	4-C(Ph)=NCH ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-C(Ph)=NPh	H	H	H
4-n-Hex	4-C(CH ₃)=NOCH ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-C(CH ₃)=NOPh	H	H	H
4-n-Hex	4-C(Ph)=NOCH ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-C(Ph)=NOPh	H	H	H
4-n-Hex	4-C(O)CH ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-C(O)CF ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-C(O)Ph	H	H	H
4-n-Hex	4-C(O)OCH ₃	H	H	H
4-n-Hex	2-C(O)OEt	H	H	H
4-n-Hex	3-C(O)OEt	H	H	H
4-n-Hex	4-C(O)OEt	H	H	H
4-n-Hex	4-C(O)OPh	H	H	H
4-n-Hex	4-C(O)OCH ₂ Ph	H	H	H
4-n-Hex	4-C(O)OCH(CH ₃)Ph	H	H	H
4-n-Hex	4-C(O)OC ₂ H ₄ Ph	H	H	H
4-n-Hex	4-SCH ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-S(O)CH ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ CH ₃	H	H	H

4-n-Hex	4-SPh	H	H	H
4-n-Hex	4-S(O)Ph	H	H	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ Ph	H	H	H
4-n-Hex	4-OS(O) ₂ CH ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-OS(O) ₂ Ph	H	H	H
4-n-Hex	4-N(CH ₃) ₂	H	H	H
4-n-Hex	4-N(CH ₂ Ph) ₂	H	H	H
4-n-Hex	4-N(CH ₃)(CH ₂ Ph)	H	H	H
4-n-Hex	4-NHCH ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-NH(CH ₂ Ph)	H	H	H
4-n-Hex	4-C(O)N(CH ₃) ₂	H	H	H
4-n-Hex	4-C(O)N(CH ₂ Ph) ₂	H	H	H
4-n-Hex	4-C(O)N(CH ₃)(CH ₂ Ph)	H	H	H
4-n-Hex	4-C(O)NHCH ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-C(O)NH(CH ₂ Ph)	H	H	H

[0095] 第2表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
4-n-Hex	4-C(O)NH{CH(CH ₃)Ph}	H	H	H
4-n-Hex	4-C(O)NH(C ₂ H ₄ Ph)	H	H	H
4-n-Hex	4-C(S)NH ₂	H	H	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ N(CH ₂ Ph) ₂	H	H	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ N(CH ₃)(CH ₂ Ph)	H	H	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ NHCH ₃	H	H	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ NHPh	H	H	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ NH(CH ₂ Ph)	H	H	H

4-n-Hex	4-S(O) ₂ NH{CH(CH ₃)Ph}	H	H	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ NH(C ₂ H ₄ Ph)	H	H	H
4-n-Hex	4-Ph	H	H	H
4-n-Hex	4-Ph	CH ₃	H	H
4-n-Hex	4-Ph	CH ₂ Ph	H	H
4-n-Hex	4-Ph	C(O)Ph	H	H
4-n-Hex	4-Ph	C(O)OEt	H	H
4-n-Hex	4-Ph	H	H	CH ₃
4-n-Hex	4-Ph	CH ₃	H	CH ₃
4-n-Hex	4-Ph	H	CH ₃	CH ₃
4-c-Hex	H	H	H	H
4-c-Hex	4-Cl	H	H	H
4-c-Hex	4-Br	H	H	H
4-c-Hex	4-CH ₃	H	H	H
4-c-Hex	4-t-Bu	H	H	H
4-c-Hex	4-t-Bu	CH ₃	H	H
4-c-Hex	4-n-Hex	H	H	H
4-c-Hex	4-n-Hex	CH ₃	H	H
4-c-Hex	4-n-Hex	H	H	CH ₃
4-c-Hex	4-n-Hex	H	CH ₃	CH ₃
4-c-Hex	4-Ph	H	H	H
4-c-Hex	4-Ph	CH ₃	H	H
3,4-(CH ₃) ₂	H	H	H	H
3,4-(CH ₃) ₂	4-Cl	H	H	H
3,4-(CH ₃) ₂	4-Br	H	H	H
3,4-(CH ₃) ₂	4-CH ₃	H	H	H
3,4-(CH ₃) ₂	4-t-Bu	H	H	H
3,4-(CH ₃) ₂	4-n-Hex	H	H	H

3,4-(CH ₃) ₂	4-Ph	H	H	H
2,4-(t-Bu) ₂	H	H	H	H
2,4-(t-Bu) ₂	4-Cl	H	H	H
2,4-(t-Bu) ₂	4-Br	H	H	H
2,4-(t-Bu) ₂	4-CH ₃	H	H	H
2,4-(t-Bu) ₂	4-t-Bu	H	H	H
2,4-(t-Bu) ₂	4-n-Hex	H	H	H
2,4-(t-Bu) ₂	4-Ph	H	H	H

[0096] 第2表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
4-CF ₃	H	H	H	H
4-CF ₃	4-Cl	H	H	H
4-CF ₃	4-Br	H	H	H
4-CF ₃	4-CH ₃	H	H	H
4-CF ₃	4-t-Bu	H	H	H
4-CF ₃	4-n-Hex	H	H	H
4-CF ₃	4-Ph	H	H	H
4-OH	H	H	H	H
4-OH	4-Cl	H	H	H
4-OH	4-Br	H	H	H
4-OH	4-CH ₃	H	H	H
4-OH	4-t-Bu	H	H	H
4-OH	4-n-Hex	H	H	H
4-OH	4-Ph	H	H	H
4-OCH ₃	H	H	H	H
4-OCH ₃	4-Cl	H	H	H

4-OCH ₃	4-Br	H	H	H
4-OCH ₃	4-CH ₃	H	H	H
4-OCH ₃	4-t-Bu	H	H	H
4-OCH ₃	4-n-Hex	H	H	H
4-OCH ₃	4-Ph	H	H	H
4-O-i-Pr	H	H	H	H
4-O-i-Pr	4-Cl	H	H	H
4-O-i-Pr	4-Br	H	H	H
4-O-i-Pr	4-CH ₃	H	H	H
4-O-i-Pr	4-t-Bu	H	H	H
4-O-i-Pr	4-n-Hex	H	H	H
4-O-i-Pr	4-Ph	H	H	H
4-O-n-Hex	H	H	H	H
4-O-n-Hex	4-Cl	H	H	H
4-O-n-Hex	4-Br	H	H	H
4-O-n-Hex	4-CH ₃	H	H	H
4-O-n-Hex	4-t-Bu	H	H	H
4-O-n-Hex	4-n-Hex	H	H	H
4-O-n-Hex	4-Ph	H	H	H
3,4-(OCH ₃) ₂	H	H	H	H
3,4-(OCH ₃) ₂	4-Cl	H	H	H
3,4-(OCH ₃) ₂	4-Br	H	H	H
3,4-(OCH ₃) ₂	4-CH ₃	H	H	H
3,4-(OCH ₃) ₂	4-t-Bu	H	H	H
3,4-(OCH ₃) ₂	4-n-Hex	H	H	H
3,4-(OCH ₃) ₂	4-Ph	H	H	H
4-OC ₂ H ₄ OEt	H	H	H	H
4-OC ₂ H ₄ OEt	4-Cl	H	H	H

4-OC₂H₄OEt 4-Br H H H

[0097] 第2表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
4-OC ₂ H ₄ OEt	4-CH ₃	H	H	H
4-OC ₂ H ₄ OEt	4-t-Bu	H	H	H
4-OC ₂ H ₄ OEt	4-n-Hex	H	H	H
4-OC ₂ H ₄ OEt	4-Ph	H	H	H
4-OPh	H	H	H	H
4-OPh	4-Cl	H	H	H
4-OPh	4-Br	H	H	H
4-OPh	4-CH ₃	H	H	H
4-OPh	4-t-Bu	H	H	H
4-OPh	4-n-Hex	H	H	H
4-OPh	4-Ph	H	H	H
4-OCH ₂ Ph	H	H	H	H
4-OCH ₂ Ph	4-Cl	H	H	H
4-OCH ₂ Ph	4-Br	H	H	H
4-OCH ₂ Ph	4-CH ₃	H	H	H
4-OCH ₂ Ph	4-t-Bu	H	H	H
4-OCH ₂ Ph	4-n-Hex	H	H	H
4-OCH ₂ Ph	4-Ph	H	H	H
4-Ph	H	H	H	H
4-Ph	4-Cl	H	H	H
4-Ph	4-Br	H	H	H
4-Ph	4-CH ₃	H	H	H
4-Ph	4-t-Bu	H	H	H

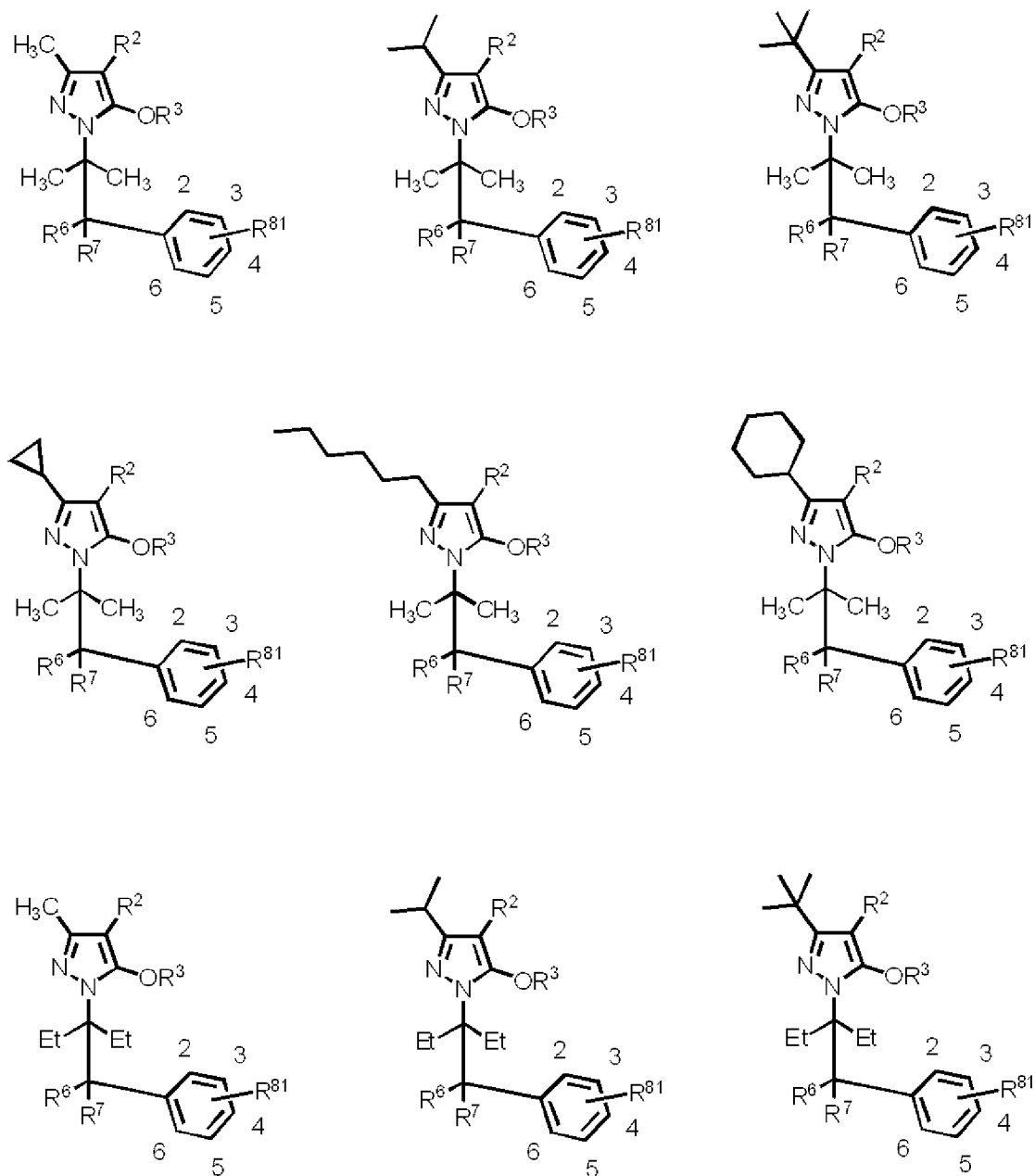
4-Ph	4-t-Bu	CH ₃	H	H
4-Ph	4-n-Hex	H	H	H
4-Ph	4-n-Hex	CH ₃	H	H
4-Ph	4-n-Hex	H	H	CH ₃
4-Ph	4-n-Hex	H	CH ₃	CH ₃
4-Ph	4-Ph	H	H	H
4-Ph	4-Ph	CH ₃	H	H

第3表

表中、置換基R⁸¹の置換位置を表す番号は、それぞれ下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものであり、－の表記は、無置換を表す。

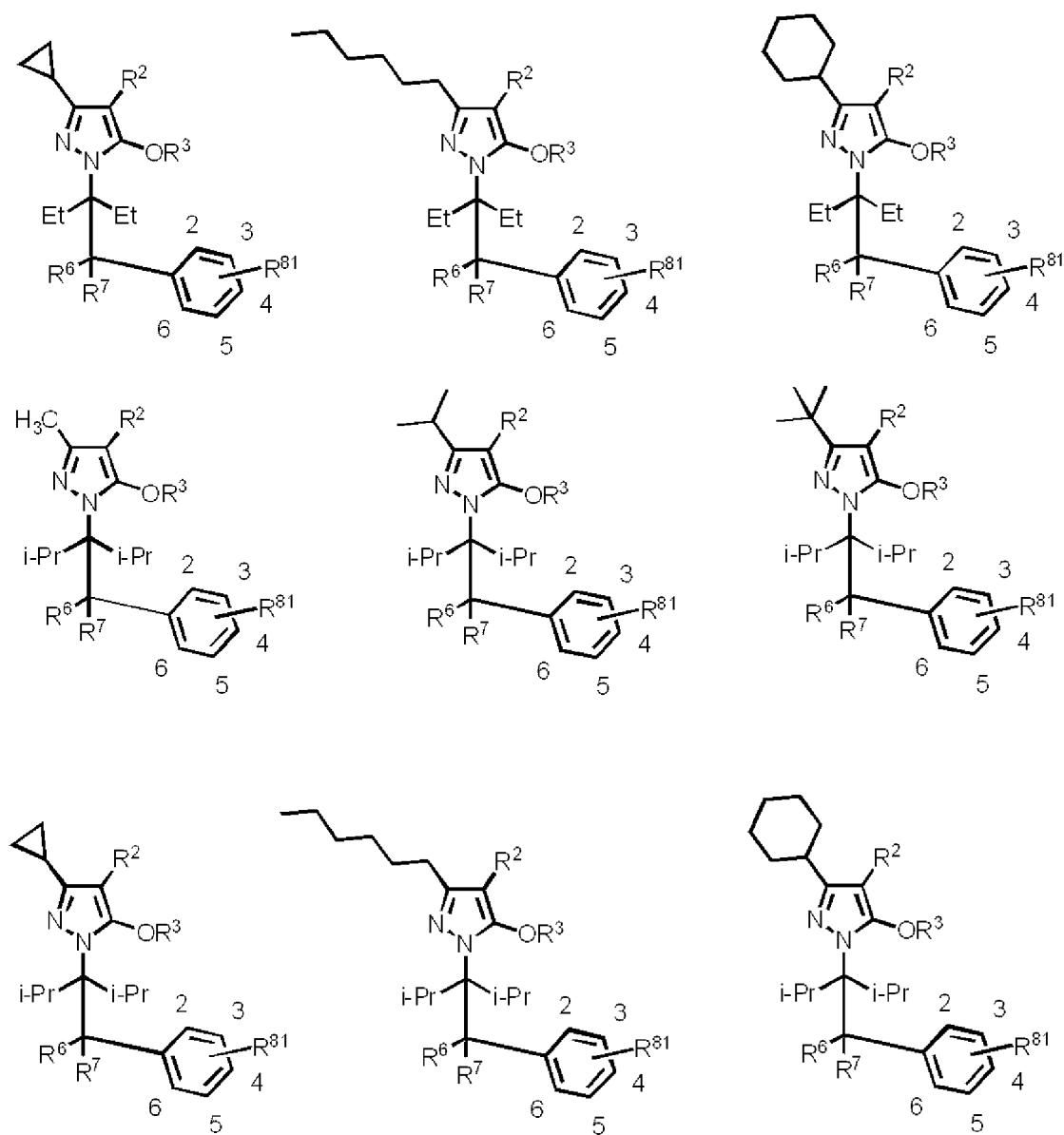
[0098]

[化26]



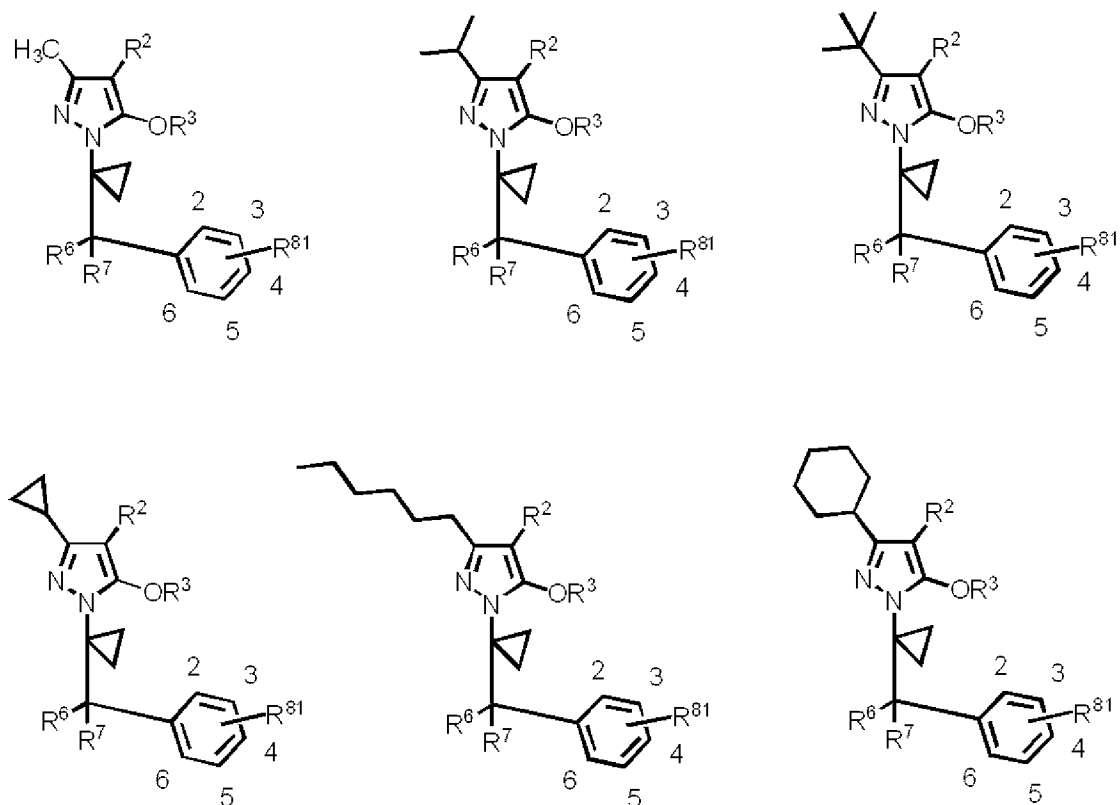
[0099]

[化27]



[0100]

[化28]



[0101]

R ²	(Z) _m	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
H	—	H	H	H	H
H	—	4-CH ₃	H	H	H
F	—	H	H	H	H
CH ₃	—	H	H	H	H
Et	—	H	H	H	H
n-Pr	—	H	H	H	H
c-Pr	—	H	H	H	H
i-Pr	—	H	H	H	H
n-Bu	—	H	H	H	H
c-Bu	—	H	H	H	H
i-Bu	—	H	H	H	H

t-Bu	-	H	H	H	H
n-Pen	-	H	H	H	H
c-Pen	-	H	H	H	H
n-Hex	-	H	H	H	H
c-Hex	-	H	H	H	H
n-C ₇ H ₁₅	-	H	H	H	H
n-C ₈ H ₁₇	-	H	H	H	H
n-C ₉ H ₁₉	-	H	H	H	H
n-C ₁₀ H ₂	-	H	H	H	H
CF ₃	-	H	H	H	H
C(Ph)=NCH ₃	-	H	H	H	H
C(CH ₃)=NPh	-	H	H	H	H
C(Ph)=NOCH ₃	-	H	H	H	H
C(O)CH ₃	-	H	H	H	H
C(O)Et	-	H	H	H	H
C(O)CF ₃	-	H	H	H	H
C(O)Ph	-	H	H	H	H
C(O)Ph	-	4-Cl	H	H	H
C(O)Ph	-	4-Cl	H	H	CH ₃
C(O)Ph	-	4-CH ₃	H	H	H
C(O)Ph	-	4-CH ₃	CH ₃	H	H
C(O)Ph	-	4-CH ₃	CH ₂ Ph	H	H
C(O)Ph	-	4-CH ₃	C(O)Ph	H	H
C(O)Ph	-	4-CH ₃	C(O)OEt	H	H
C(O)Ph	-	4-CH ₃	H	H	CH ₃
C(O)Ph	-	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
C(O)Ph	-	4-t-Bu	H	H	H
C(O)Ph	-	4-t-Bu	H	H	CH ₃

C(O)Ph	—	4-n-hex	H	H	H
C(O)Ph	—	4-n-hex	H	H	CH ₃
C(O)Ph	—	4-OCH ₃	H	H	H
C(O)Ph	—	4-OCH ₃	H	H	CH ₃
C(O)Ph	—	4-Ph	H	H	H
C(O)Ph	—	4-Ph	H	H	CH ₃
C(O)CH ₂ Ph	—	H	H	H	H

[0102] 第3表 (続き)

R ²	(Z) _m	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
C(O)CH(CH ₃)Ph	—	H	H	H	H
C(O)C ₂ H ₄ Ph	—	H	H	H	H
C(O)OCH ₃	—	H	H	H	H
C(O)OEt	—	H	H	H	H
C(O)OEt	—	4-Cl	H	H	H
C(O)OEt	—	4-Cl	H	H	CH ₃
C(O)OEt	—	4-CH ₃	H	H	H
C(O)OEt	—	4-CH ₃	CH ₃	H	H
C(O)OEt	—	4-CH ₃	CH ₂ Ph	H	H
C(O)OEt	—	4-CH ₃	C(O)Ph	H	H
C(O)OEt	—	4-CH ₃	C(O)OEt	H	H
C(O)OEt	—	4-CH ₃	H	H	CH ₃
C(O)OEt	—	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
C(O)OEt	—	4-t-Bu	H	H	H
C(O)OEt	—	4-t-Bu	H	H	CH ₃
C(O)OEt	—	4-n-hex	H	H	H
C(O)OEt	—	4-n-hex	H	H	CH ₃

C(O)OEt	—	4-OCH ₃	H	H	H
C(O)OEt	—	4-OCH ₃	H	H	CH ₃
C(O)OEt	—	4-Ph	H	H	H
C(O)OEt	—	4-Ph	H	H	CH ₃
C(O)OPh	—	H	H	H	H
C(O)OCH ₂ Ph	—	H	H	H	H
C(O)OCH(CH ₃)Ph	—	H	H	H	H
C(O)OC ₂ H ₄ Ph	—	H	H	H	H
C(O)N(CH ₃) ₂	—	H	H	H	H
C(O)NHCH ₃	—	H	H	H	H
C(O)NH(CH ₂ Ph)	—	H	H	H	H
CH ₂ Ph	—	H	H	H	H
CH ₂ (4-Cl-Ph)	—	H	H	H	H
A001	H	H	H	H	H
A001	3-n-Bu	H	H	H	H
A002	H	H	H	H	H
A002	2-Cl	H	H	H	H
A003	H	H	H	H	H
A004	H	H	H	H	H
A005	H	H	H	H	H
A005	H	4-Cl	H	H	H
A005	H	4-Cl	H	H	CH ₃
A005	H	4-CH ₃	H	H	H
A005	H	4-CH ₃	CH ₃	H	H
A005	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph	H	H
A005	H	4-CH ₃	C(O)Ph	H	H
A005	H	4-CH ₃	C(O)OEt	H	H
A005	H	4-CH ₃	H	H	CH ₃

[0103] 第3表 (続き)

R ²	(Z) _m	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
A005	H	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
A005	H	4-t-Bu	H	H	H
A005	H	4-t-Bu	H	H	CH ₃
A005	H	4-n-hex	H	H	H
A005	H	4-n-hex	H	H	CH ₃
A005	H	4-OCH ₃	H	H	H
A005	H	4-OCH ₃	H	H	CH ₃
A005	H	4-Ph	H	H	H
A005	H	4-Ph	H	H	CH ₃
A005	2,5-(CH ₃) ₂	H	H	H	H
A005	2,5-Cl ₂	H	H	H	H
A005	2-Br	H	H	H	H
A006	H	H	H	H	H
A006	H	4-Cl	H	H	H
A006	H	4-Cl	H	H	CH ₃
A006	H	4-CH ₃	H	H	H
A006	H	4-CH ₃	CH ₃	H	H
A006	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph	H	H
A006	H	4-CH ₃	C(O)Ph	H	H
A006	H	4-CH ₃	C(O)OEt	H	H
A006	H	4-CH ₃	H	H	CH ₃
A006	H	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
A006	H	4-t-Bu	H	H	H
A006	H	4-t-Bu	H	H	CH ₃

A006	H	4-n-hex	H	H	H
A006	H	4-n-hex	H	H	CH ₃
A006	H	4-OCH ₃	H	H	H
A006	H	4-OCH ₃	H	H	CH ₃
A006	H	4-Ph	H	H	H
A006	H	4-Ph	H	H	CH ₃
A006	3-CH ₃	H	H	H	H
A006	5-CH ₃	H	H	H	H
A006	3-Cl	H	H	H	H
A006	5-Et	H	H	H	H
A006	5-Cl	H	H	H	H
A006	5-Br	H	H	H	H
A006	3-Br	H	H	H	H
A006	4-Br	H	H	H	H
A006	5-NO ₂	H	H	H	H
A007	H	H	H	H	H
A007	5-CH ₃	H	H	H	H
A007	3-CH ₃	H	H	H	H
A007	5-Br	H	H	H	H
A007	5-NO ₂	H	H	H	H
A007	5-Ph	H	H	H	H

[0104] 第3表 (続き)

R ²	(Z) _m	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
A008	5-CH ₃	H	H	H	H
A009	5-CH ₃	H	H	H	H
A010	3, 5-(CH ₃) ₂	H	H	H	H

A010	3,5-Cl ₂	H	H	H	H
A011	3,5-(CH ₃) ₂	H	H	H	H
A011	3,5-Cl ₂	H	H	H	H
A012	3-CH ₃	H	H	H	H
A012	3-CH ₃	H	H	H	H
A012	3-Cl	H	H	H	H
A013	3-CH ₃	H	H	H	H
A013	3-CH ₃	H	H	H	H
A013	3-Cl	H	H	H	H
A014	H	H	H	H	H
A014	H	4-Cl	H	H	H
A014	H	4-Cl	H	H	CH ₃
A014	H	4-CH ₃	H	H	H
A014	H	4-CH ₃	CH ₃	H	H
A014	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph	H	H
A014	H	4-CH ₃	C(O)Ph	H	H
A014	H	4-CH ₃	C(O)OEt	H	H
A014	H	4-CH ₃	H	H	CH ₃
A014	H	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
A014	H	4-t-Bu	H	H	H
A014	H	4-t-Bu	H	H	CH ₃
A014	H	4-n-hex	H	H	H
A014	H	4-n-hex	H	H	CH ₃
A014	H	4-OCH ₃	H	H	H
A014	H	4-OCH ₃	H	H	CH ₃
A014	H	4-Ph	H	H	H
A014	H	4-Ph	H	H	CH ₃
A015	H	H	H	H	H

A016	2,4-(CH ₃) ₂	H	H	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-Cl	H	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₃
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-CH ₃	H	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-CH ₃	CH ₃	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-CH ₃	CH ₂ Ph	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-CH ₃	C(O)Ph	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-CH ₃	C(O)OEt	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-CH ₃	H	H	CH ₃
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-t-Bu	H	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-t-Bu	H	H	CH ₃
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-n-hex	H	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-n-hex	H	H	CH ₃

[0105] 第3表 (続き)

R ²	(Z) _m	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-OCH ₃	H	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-OCH ₃	H	H	CH ₃
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-Ph	H	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-Ph	H	H	CH ₃
A017	2,4-(CH ₃) ₂	H	H	H	H
A018	H	H	H	H	H
A018	3-CH ₃	H	H	H	H
A019	3-Ph, 5-CH ₃	H	H	H	H
A019	3,5-(CH ₃) ₂	H	H	H	H
A020	5-CH ₃	H	H	H	H

A021	4-CH ₃	H	H	H	H
A022	H	H	H	H	H
A023	2,4-(CH ₃) ₂	H	H	H	H
A024	2-(4-pyridil)	H	H	H	H
A025	H	H	H	H	H
A026	H	H	H	H	H
A026	4-CH ₃	H	H	H	H
A027	H	H	H	H	H
A027	4-CH ₃	H	H	H	H
A028	H	H	H	H	H
A029	H	H	H	H	H
A030	H	H	H	H	H
A031	H	H	H	H	H
A032	H	H	H	H	H
A033	H	H	H	H	H
A034	H	H	H	H	H
A034	3,6-Cl ₂	H	H	H	H
A035	H	H	H	H	H
A036	H	H	H	H	H
A036	H	4-Cl	H	H	H
A036	H	4-Cl	H	H	CH ₃
A036	H	4-CH ₃	H	H	H
A036	H	4-CH ₃	CH ₃	H	H
A036	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph	H	H
A036	H	4-CH ₃	C(O)Ph	H	H
A036	H	4-CH ₃	C(O)OEt	H	H
A036	H	4-CH ₃	H	H	CH ₃
A036	H	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃

A036	H	4-t-Bu	H	H	H
A036	H	4-t-Bu	H	H	CH ₃
A036	H	4-n-hex	H	H	H
A036	H	4-n-hex	H	H	CH ₃
A036	H	4-OCH ₃	H	H	H
A036	H	4-OCH ₃	H	H	CH ₃
A036	H	4-Ph	H	H	H

[0106] 第3表 (続き)

R ²	(Z) _m	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
A036	H	4-Ph	H	H	CH ₃
A037	H	H	H	H	H
A037	H	4-Cl	H	H	H
A037	H	4-Cl	H	H	CH ₃
A037	H	4-CH ₃	H	H	H
A037	H	4-CH ₃	CH ₃	H	H
A037	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph	H	H
A037	H	4-CH ₃	C(O)Ph	H	H
A037	H	4-CH ₃	C(O)OEt	H	H
A037	H	4-CH ₃	H	H	CH ₃
A037	H	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
A037	H	4-t-Bu	H	H	H
A037	H	4-t-Bu	H	H	CH ₃
A037	H	4-n-hex	H	H	H
A037	H	4-n-hex	H	H	CH ₃
A037	H	4-OCH ₃	H	H	H
A037	H	4-OCH ₃	H	H	CH ₃

A037	H	4-Ph	H	H	H
A037	H	4-Ph	H	H	CH ₃
A037	6-OCH ₃	H	H	H	H
A037	6-Br	H	H	H	H
A038	H	H	H	H	H
A038	H	4-Cl	H	H	H
A038	H	4-Cl	H	H	CH ₃
A038	H	4-CH ₃	H	H	H
A038	H	4-CH ₃	CH ₃	H	H
A038	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph	H	H
A038	H	4-CH ₃	C(O)Ph	H	H
A038	H	4-CH ₃	C(O)OEt	H	H
A038	H	4-CH ₃	H	H	CH ₃
A038	H	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
A038	H	4-t-Bu	H	H	H
A038	H	4-t-Bu	H	H	CH ₃
A038	H	4-n-hex	H	H	H
A038	H	4-n-hex	H	H	CH ₃
A038	H	4-OCH ₃	H	H	H
A038	H	4-OCH ₃	H	H	CH ₃
A038	H	4-Ph	H	H	H
A038	H	4-Ph	H	H	CH ₃
A038	2-OCH ₃	H	H	H	H
A038	4-OCH ₃	H	H	H	H
A038	4-F	H	H	H	H
A039	H	H	H	H	H
A039	3-CH ₃	H	H	H	H
A039	7-OCH ₃	H	H	H	H

[0107] 第3表 (続き)

R ²	(Z) _m	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
A040	H	H	H	H	H
A041	H	H	H	H	H
A041	H	4-Cl	H	H	H
A041	H	4-Cl	H	H	CH ₃
A041	H	4-CH ₃	H	H	H
A041	H	4-CH ₃	CH ₃	H	H
A041	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph	H	H
A041	H	4-CH ₃	C(O)Ph	H	H
A041	H	4-CH ₃	C(O)OEt	H	H
A041	H	4-CH ₃	H	H	CH ₃
A041	H	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
A041	H	4-t-Bu	H	H	H
A041	H	4-t-Bu	H	H	CH ₃
A041	H	4-n-hex	H	H	H
A041	H	4-n-hex	H	H	CH ₃
A041	H	4-OCH ₃	H	H	H
A041	H	4-OCH ₃	H	H	CH ₃
A041	H	4-Ph	H	H	H
A041	H	4-Ph	H	H	CH ₃
A041	6-NO ₂	H	H	H	H
A041	6-Br	H	H	H	H
A042	H	H	H	H	H
A042	H	4-Cl	H	H	H
A042	H	4-Cl	H	H	CH ₃

A042	H	4-CH ₃	H	H	H
A042	H	4-CH ₃	CH ₃	H	H
A042	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph	H	H
A042	H	4-CH ₃	C(O)Ph	H	H
A042	H	4-CH ₃	C(O)OEt	H	H
A042	H	4-CH ₃	H	H	CH ₃
A042	H	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
A042	H	4-t-Bu	H	H	H
A042	H	4-t-Bu	H	H	CH ₃
A042	H	4-n-hex	H	H	H
A042	H	4-n-hex	H	H	CH ₃
A042	H	4-OCH ₃	H	H	H
A042	H	4-OCH ₃	H	H	CH ₃
A042	H	4-Ph	H	H	H
A042	H	4-Ph	H	H	CH ₃
A042	5-Br	H	H	H	H
A043	H	H	H	H	H
A044	H	H	H	H	H
A051	-	H	H	H	H
A052	-	H	H	H	H
A053	-	H	H	H	H

[0108] 第3表 (続き)

R ²	(Z) _m	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
A054	-	H	H	H	H
A055	-	H	H	H	H
A056	-	H	H	H	H

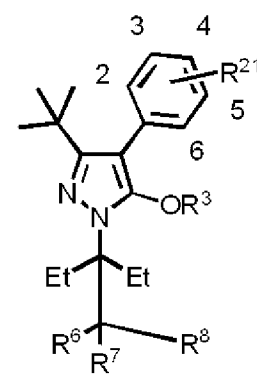
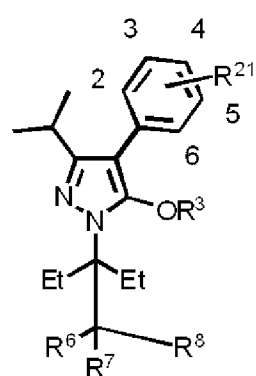
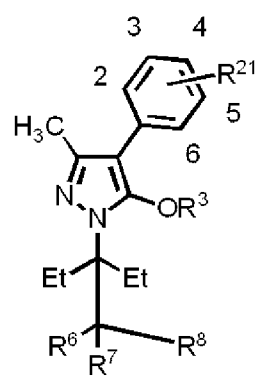
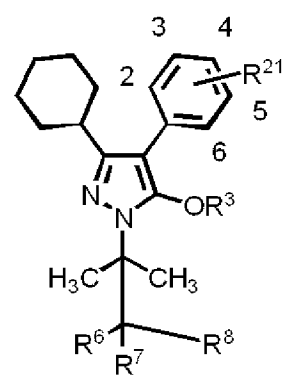
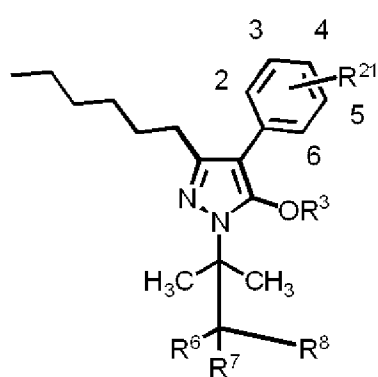
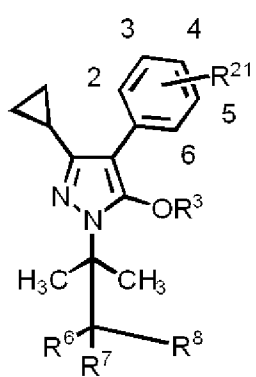
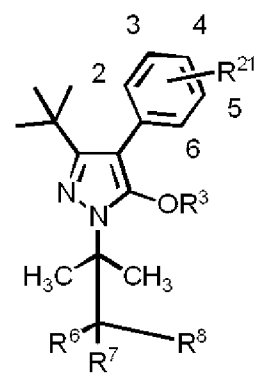
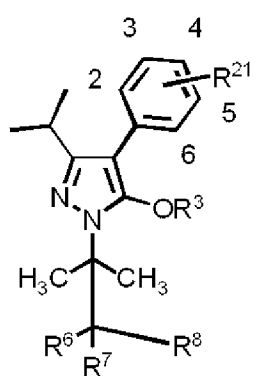
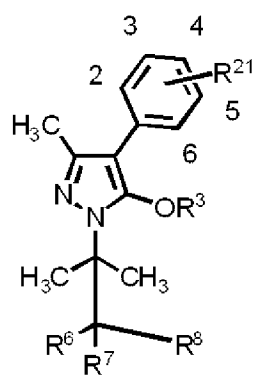
A057	-	H	H	H	H
A058	-	H	H	H	H
A059	-	H	H	H	H
A060	-	H	H	H	H
A061	-	H	H	H	H
A062	-	H	H	H	H
A063	-	H	H	H	H
A064	-	H	H	H	H
A065	-	H	H	H	H
A066	-	H	H	H	H
A067	-	H	H	H	H
A068	-	H	H	H	H
A101	-	H	H	H	H
A102	-	H	H	H	H
A103	-	H	H	H	H
A104	-	H	H	H	H
A105	-	H	H	H	H
A106	-	H	H	H	H
A107	-	H	H	H	H

第4表

表中、置換基 R^{21} の置換位置を表す番号は、それぞれ下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものであり、一の表記は、無置換を表す。

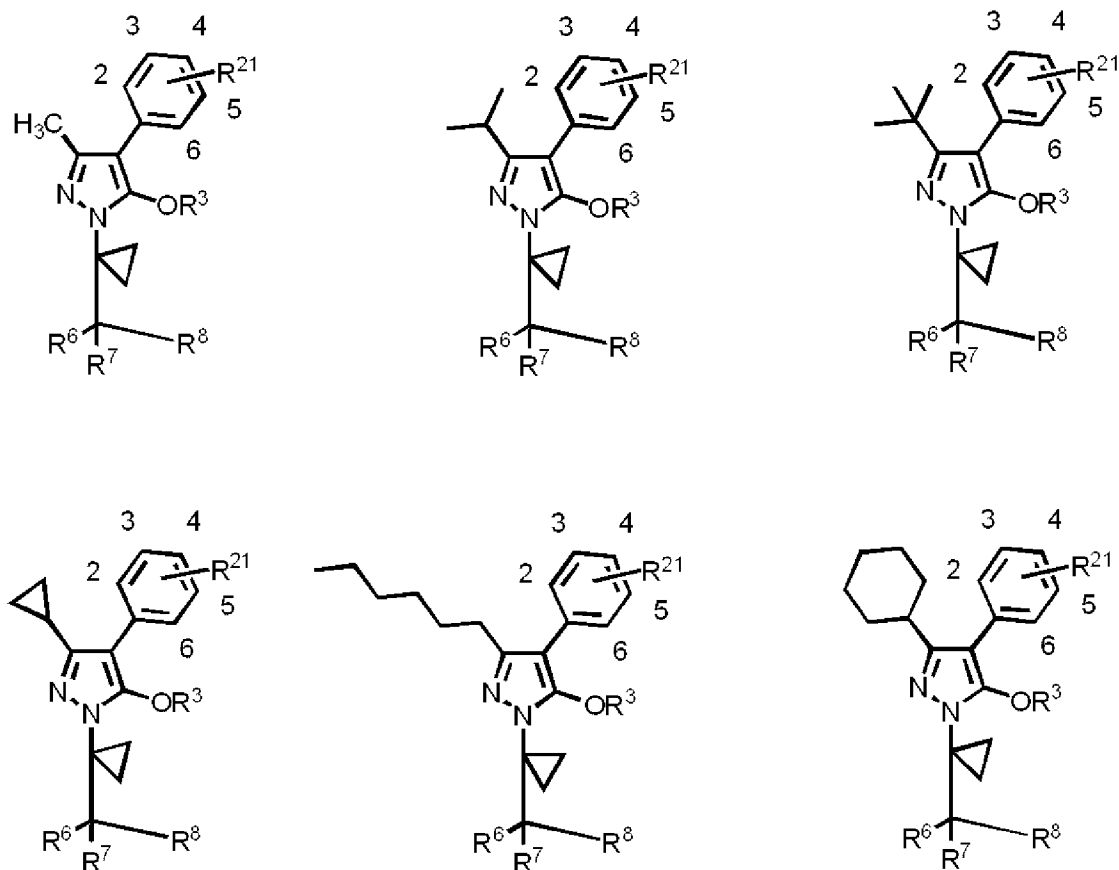
[0109]

[化29]



[0110]

[化31]



[0112]

R ²¹	R ⁸	(Z) _m	R ³	R ⁶	R ⁷
H	c-Pr	—	H	H	H
4-Cl	c-Pr	—	H	H	H
4-Cl	c-Pr	—	H	H	CH ₃
4-CH ₃	c-Pr	—	H	H	H
4-CH ₃	c-Pr	—	CH ₃	H	H
4-CH ₃	c-Pr	—	CH ₂ Ph	H	H
4-CH ₃	c-Pr	—	C(O)Ph	H	H
4-CH ₃	c-Pr	—	C(O)OEt	H	H
4-CH ₃	c-Pr	—	H	H	CH ₃
4-CH ₃	c-Pr	—	H	CH ₃	CH ₃

4-t-Bu	c-Pr	-	H	H	H
4-t-Bu	c-Pr	-	H	H	CH ₃
4-n-hex	c-Pr	-	H	H	H
4-n-hex	c-Pr	-	CH ₃	H	H
4-n-hex	c-Pr	-	CH ₂ Ph	H	H
4-n-hex	c-Pr	-	C(O)Ph	H	H
4-n-hex	c-Pr	-	C(O)OEt	H	H
4-n-hex	c-Pr	-	H	H	CH ₃
4-n-hex	c-Pr	-	H	CH ₃	CH ₃
4-OCH ₃	c-Pr	-	H	H	H
4-OCH ₃	c-Pr	-	H	H	CH ₃
4-Ph	c-Pr	-	H	H	H
4-Ph	c-Pr	-	H	H	CH ₃
H	c-Bu	-	H	H	H
H	c-Pen	-	H	H	H
H	c-Hex	-	H	H	H
4-Cl	c-Hex	-	H	H	H
4-Cl	c-Hex	-	H	H	CH ₃
4-CH ₃	c-Hex	-	H	H	H
4-CH ₃	c-Hex	-	CH ₃	H	H
4-CH ₃	c-Hex	-	CH ₂ Ph	H	H
4-CH ₃	c-Hex	-	C(O)Ph	H	H
4-CH ₃	c-Hex	-	C(O)OEt	H	H
4-CH ₃	c-Hex	-	H	H	CH ₃
4-CH ₃	c-Hex	-	H	CH ₃	CH ₃
4-t-Bu	c-Hex	-	H	H	H
4-t-Bu	c-Hex	-	H	H	CH ₃
4-n-hex	c-Hex	-	H	H	H

4-n-hex	c-Hex	-	CH ₃	H	H
4-n-hex	c-Hex	-	CH ₂ Ph	H	H
4-n-hex	c-Hex	-	C(O)Ph	H	H
4-n-hex	c-Hex	-	C(O)OEt	H	H
4-n-hex	c-Hex	-	H	H	CH ₃
4-n-hex	c-Hex	-	H	CH ₃	CH ₃
4-OCH ₃	c-Hex	-	H	H	H
4-OCH ₃	c-Hex	-	H	H	CH ₃

[0113] 第4表 (続き)

R ²¹	R ⁸	(Z) _m	R ³	R ⁶	R ⁷
4-Ph	c-Hex	-	H	H	H
4-Ph	c-Hex	-	H	H	CH ₃
H	c-C ₇ H ₁₅	-	H	H	H
H	c-C ₈ H ₁₇	-	H	H	H
H	bicyclo[2.2.1]heptan-2-yl	-	H	H	H
H	1-adamantyl	-	H	H	H
H	2-adamantyl	-	H	H	H
H	A001	H	H	H	H
H	A001	3-n-Bu	H	H	H
H	A002	H	H	H	H
H	A002	2-Cl	H	H	H
H	A003	H	H	H	H
H	A004	H	H	H	H
H	A005	H	H	H	H
4-Cl	A005	H	H	H	H
4-Cl	A005	H	H	H	CH ₃

4-CH ₃	A005	H	H	H	H
4-CH ₃	A005	H	CH ₃	H	H
4-CH ₃	A005	H	CH ₂ Ph	H	H
4-CH ₃	A005	H	C(O)Ph	H	H
4-CH ₃	A005	H	C(O)OEt	H	H
4-CH ₃	A005	H	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A005	H	H	CH ₃	CH ₃
4-t-Bu	A005	H	H	H	H
4-t-Bu	A005	H	H	H	CH ₃
4-n-hex	A005	H	H	H	H
4-n-hex	A005	H	CH ₃	H	H
4-n-hex	A005	H	CH ₂ Ph	H	H
4-n-hex	A005	H	C(O)Ph	H	H
4-n-hex	A005	H	C(O)OEt	H	H
4-n-hex	A005	H	H	H	CH ₃
4-n-hex	A005	H	H	CH ₃	CH ₃
4-OCH ₃	A005	H	H	H	H
4-OCH ₃	A005	H	H	H	CH ₃
4-Ph	A005	H	H	H	H
4-Ph	A005	H	H	H	CH ₃
H	A005	2, 5-(CH ₃) ₂	H	H	H
H	A005	2, 5-Cl ₂	H	H	H
H	A005	2-Br	H	H	H
H	A006	H	H	H	H
4-Cl	A006	H	H	H	H
4-Cl	A006	H	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A006	H	H	H	H
4-CH ₃	A006	H	CH ₃	H	H

4-CH₃ A006 H CH₂Ph H H

[0114] 第4表 (続き)

R ²¹	R ⁸	(Z) _m	R ³	R ⁶	R ⁷
4-CH ₃	A006	H	C(O)Ph	H	H
4-CH ₃	A006	H	C(O)OEt	H	H
4-CH ₃	A006	H	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A006	H	H	CH ₃	CH ₃
4-t-Bu	A006	H	H	H	H
4-t-Bu	A006	H	H	H	CH ₃
4-n-hex	A006	H	H	H	H
4-n-hex	A006	H	CH ₃	H	H
4-n-hex	A006	H	CH ₂ Ph	H	H
4-n-hex	A006	H	C(O)Ph	H	H
4-n-hex	A006	H	C(O)OEt	H	H
4-n-hex	A006	H	H	H	CH ₃
4-n-hex	A006	H	H	CH ₃	CH ₃
4-OCH ₃	A006	H	H	H	H
4-OCH ₃	A006	H	H	H	CH ₃
4-Ph	A006	H	H	H	H
4-Ph	A006	H	H	H	CH ₃
H	A006	3-CH ₃	H	H	H
H	A006	5-CH ₃	H	H	H
H	A006	3-Cl	H	H	H
H	A006	5-Et	H	H	H
H	A006	5-Cl	H	H	H
H	A006	5-Br	H	H	H

H	A006	3-Br	H	H	H
H	A006	4-Br	H	H	H
H	A006	5-NO ₂	H	H	H
H	A007	H	H	H	H
H	A007	5-CH ₃	H	H	H
H	A007	3-CH ₃	H	H	H
H	A007	5-Br	H	H	H
H	A007	5-NO ₂	H	H	H
H	A007	5-Ph	H	H	H
H	A008	5-CH ₃	H	H	H
H	A009	5-CH ₃	H	H	H
H	A010	3, 5-(CH ₃) ₂	H	H	H
H	A010	3, 5-Cl ₂	H	H	H
H	A011	3, 5-(CH ₃) ₂	H	H	H
H	A011	3, 5-Cl ₂	H	H	H
H	A012	3-CH ₃	H	H	H
H	A012	3-Me	H	H	H
H	A012	3-Cl	H	H	H
H	A013	3-CH ₃	H	H	H
H	A013	3-Me	H	H	H
H	A013	3-Cl	H	H	H
H	A014	H	H	H	H

[0115] 第4表 (続き)

R ²¹	R ⁸	(Z) _m	R ³	R ⁶	R ⁷
4-Cl	A014	H	H	H	H
4-Cl	A014	H	H	H	CH ₃

4-CH ₃	A014	H	H	H	H
4-CH ₃	A014	H	CH ₃	H	H
4-CH ₃	A014	H	CH ₂ Ph	H	H
4-CH ₃	A014	H	C(O)Ph	H	H
4-CH ₃	A014	H	C(O)OEt	H	H
4-CH ₃	A014	H	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A014	H	H	CH ₃	CH ₃
4-t-Bu	A014	H	H	H	H
4-t-Bu	A014	H	H	H	CH ₃
4-n-hex	A014	H	H	H	H
4-n-hex	A014	H	H	H	CH ₃
4-OCH ₃	A014	H	H	H	H
4-OCH ₃	A014	H	H	H	CH ₃
4-Ph	A014	H	H	H	H
4-Ph	A014	H	H	H	CH ₃
H	A015	H	H	H	H
H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
4-Cl	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
4-Cl	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
4-CH ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H
4-CH ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	CH ₂ Ph	H	H
4-CH ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	C(O)Ph	H	H
4-CH ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	C(O)OEt	H	H
4-CH ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	CH ₃	CH ₃
4-t-Bu	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
4-t-Bu	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	CH ₃

4-n-hex	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
4-n-hex	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	CH ₃
4-OCH ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
4-OCH ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	CH ₃
4-Ph	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
4-Ph	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	CH ₃
H	A017	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
H	A018	H	H	H	H
H	A018	3-CH ₃	H	H	H
H	A019	3-Ph, 5-CH ₃	H	H	H
H	A019	3, 5-(CH ₃) ₂	H	H	H
H	A020	5-CH ₃	H	H	H
H	A021	4-CH ₃	H	H	H
H	A022	H	H	H	H
H	A023	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H

[0116] 第4表 (続き)

R ²¹	R ⁸	(Z) _m	R ³	R ⁶	R ⁷
H	A024	2-(4-pyridil)	H	H	H
H	A025	H	H	H	H
H	A026	H	H	H	H
H	A026	4-CH ₃	H	H	H
H	A027	H	H	H	H
H	A027	4-CH ₃	H	H	H
H	A028	H	H	H	H
H	A029	H	H	H	H
H	A030	H	H	H	H

H	A031	H	H	H	H
H	A032	H	H	H	H
H	A033	H	H	H	H
H	A034	H	H	H	H
H	A034	3,6-Cl ₂	H	H	H
H	A035	H	H	H	H
H	A036	H	H	H	H
H	A037	H	H	H	H
4-Cl	A037	H	H	H	H
4-Cl	A037	H	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A037	H	H	H	H
4-CH ₃	A037	H	CH ₃	H	H
4-CH ₃	A037	H	CH ₂ Ph	H	H
4-CH ₃	A037	H	C(O)Ph	H	H
4-CH ₃	A037	H	C(O)OEt	H	H
4-CH ₃	A037	H	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A037	H	H	CH ₃	CH ₃
4-t-Bu	A037	H	H	H	H
4-t-Bu	A037	H	H	H	CH ₃
4-n-hex	A037	H	H	H	H
4-n-hex	A037	H	CH ₃	H	H
4-n-hex	A037	H	CH ₂ Ph	H	H
4-n-hex	A037	H	C(O)Ph	H	H
4-n-hex	A037	H	C(O)OEt	H	H
4-n-hex	A037	H	H	H	CH ₃
4-n-hex	A037	H	H	CH ₃	CH ₃
4-OCH ₃	A037	H	H	H	H
4-OCH ₃	A037	H	H	H	CH ₃

4-Ph	A037	H	H	H	H
4-Ph	A037	H	H	H	CH ₃
H	A037	6-OCH ₃	H	H	H
H	A037	6-Br	H	H	H
H	A038	H	H	H	H
4-Cl	A038	H	H	H	H
4-Cl	A038	H	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A038	H	H	H	H

[0117] 第4表 (続き)

R ²¹	R ⁸	(Z) _m	R ³	R ⁶	R ⁷
4-CH ₃	A038	H	CH ₃	H	H
4-CH ₃	A038	H	CH ₂ Ph	H	H
4-CH ₃	A038	H	C(O)Ph	H	H
4-CH ₃	A038	H	C(O)OEt	H	H
4-CH ₃	A038	H	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A038	H	H	CH ₃	CH ₃
4-t-Bu	A038	H	H	H	H
4-t-Bu	A038	H	H	H	CH ₃
4-n-hex	A038	H	H	H	H
4-n-hex	A038	H	CH ₃	H	H
4-n-hex	A038	H	CH ₂ Ph	H	H
4-n-hex	A038	H	C(O)Ph	H	H
4-n-hex	A038	H	C(O)OEt	H	H
4-n-hex	A038	H	H	H	CH ₃
4-n-hex	A038	H	H	CH ₃	CH ₃
4-OCH ₃	A038	H	H	H	H

4-OCH ₃	A038	H	H	H	CH ₃
4-Ph	A038	H	H	H	H
4-Ph	A038	H	H	H	CH ₃
H	A038	2-OCH ₃	H	H	H
H	A038	4-OCH ₃	H	H	H
H	A038	4-F	H	H	H
H	A039	H	H	H	H
H	A039	3-CH ₃	H	H	H
H	A039	7-OCH ₃	H	H	H
H	A040	H	H	H	H
H	A041	H	H	H	H
4-Cl	A041	H	H	H	H
4-Cl	A041	H	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A041	H	H	H	H
4-CH ₃	A041	H	CH ₃	H	H
4-CH ₃	A041	H	CH ₂ Ph	H	H
4-CH ₃	A041	H	C(O)Ph	H	H
4-CH ₃	A041	H	C(O)OEt	H	H
4-CH ₃	A041	H	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A041	H	H	CH ₃	CH ₃
4-t-Bu	A041	H	H	H	H
4-t-Bu	A041	H	H	H	CH ₃
4-n-hex	A041	H	H	H	H
4-n-hex	A041	H	H	H	CH ₃
4-OCH ₃	A041	H	H	H	H
4-OCH ₃	A041	H	H	H	CH ₃
4-Ph	A041	H	H	H	H
4-Ph	A041	H	H	H	CH ₃

H A041 6-NO₂ H H H

[0118] 第4表 (続き)

R ²¹	R ⁸	(Z) _m	R ³	R ⁶	R ⁷
H	A041	6-Br	H	H	H
H	A042	H	H	H	H
4-Cl	A042	H	H	H	H
4-Cl	A042	H	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A042	H	H	H	H
4-CH ₃	A042	H	CH ₃	H	H
4-CH ₃	A042	H	CH ₂ Ph	H	H
4-CH ₃	A042	H	C(O)Ph	H	H
4-CH ₃	A042	H	C(O)OEt	H	H
4-CH ₃	A042	H	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A042	H	H	CH ₃	CH ₃
4-t-Bu	A042	H	H	H	H
4-t-Bu	A042	H	H	H	CH ₃
4-n-hex	A042	H	H	H	H
4-n-hex	A042	H	H	H	CH ₃
4-OCH ₃	A042	H	H	H	H
4-OCH ₃	A042	H	H	H	CH ₃
4-Ph	A042	H	H	H	H
4-Ph	A042	H	H	H	CH ₃
H	A042	5-Br	H	H	H
H	A043	H	H	H	H
4-Cl	A043	H	H	H	H
4-Cl	A043	H	H	H	CH ₃

4-CH ₃	A043	H	H	H	H
4-CH ₃	A043	H	CH ₃	H	H
4-CH ₃	A043	H	CH ₂ Ph	H	H
4-CH ₃	A043	H	C(O)Ph	H	H
4-CH ₃	A043	H	C(O)OEt	H	H
4-CH ₃	A043	H	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A043	H	H	CH ₃	CH ₃
4-t-Bu	A043	H	H	H	H
4-t-Bu	A043	H	H	H	CH ₃
4-n-hex	A043	H	H	H	H
4-n-hex	A043	H	H	H	CH ₃
4-OCH ₃	A043	H	H	H	H
4-OCH ₃	A043	H	H	H	CH ₃
4-Ph	A043	H	H	H	H
4-Ph	A043	H	H	H	CH ₃
H	A044	H	H	H	H
4-Cl	A044	H	H	H	H
4-Cl	A044	H	H	H	CH ₃
4-CH ₃	A044	H	H	H	H
4-CH ₃	A044	H	CH ₃	H	H
4-CH ₃	A044	H	CH ₂ Ph	H	H
4-CH ₃	A044	H	C(O)Ph	H	H

[0119] 第4表 (続き)

R ²¹	R ⁸	(Z) _m	R ³	R ⁶	R ⁷
4-CH ₃	A044	H	C(O)OEt	H	H
4-CH ₃	A044	H	H	H	CH ₃

4-CH ₃	A044	H	H	CH ₃	CH ₃
4-t-Bu	A044	H	H	H	H
4-t-Bu	A044	H	H	H	CH ₃
4-n-hex	A044	H	H	H	H
4-n-hex	A044	H	H	H	CH ₃
4-OCH ₃	A044	H	H	H	H
4-OCH ₃	A044	H	H	H	CH ₃
4-Ph	A044	H	H	H	H
4-Ph	A044	H	H	H	CH ₃
H	A051	—	H	H	H
H	A052	—	H	H	H
H	A053	—	H	H	H
H	A054	—	H	H	H
H	A055	—	H	H	H
H	A056	—	H	H	H
H	A057	—	H	H	H
H	A058	—	H	H	H
H	A059	—	H	H	H
H	A060	—	H	H	H
H	A061	—	H	H	H
H	A062	—	H	H	H
H	A063	—	H	H	H
H	A064	—	H	H	H
H	A065	—	H	H	H
H	A066	—	H	H	H
H	A067	—	H	H	H
H	A068	—	H	H	H
H	A101	—	H	H	H

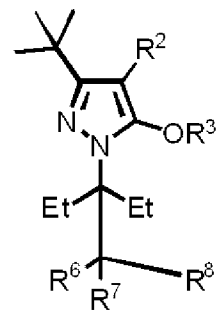
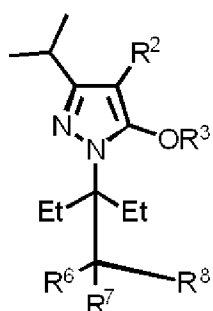
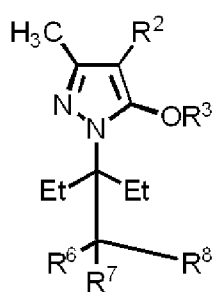
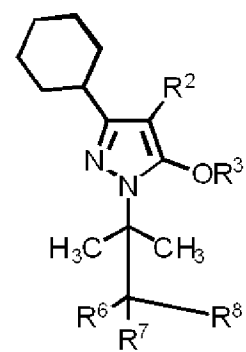
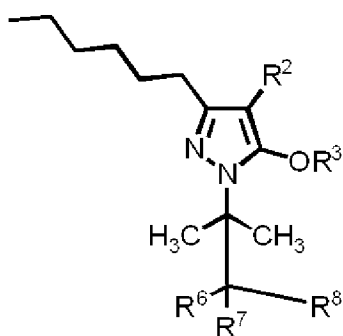
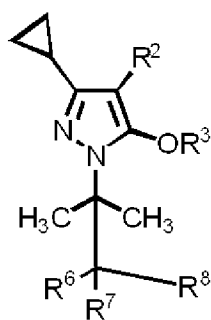
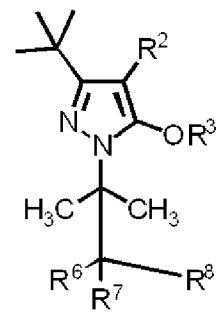
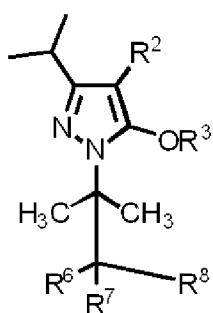
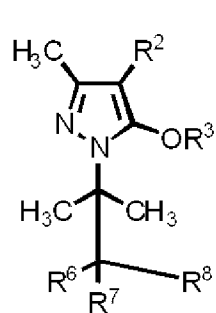
H	A102	—	H	H	H
H	A103	—	H	H	H
H	A104	—	H	H	H
H	A105	—	H	H	H
H	A106	—	H	H	H
H	A107	—	H	H	H

第 5 表

表中、—の表記は、無置換を表す。

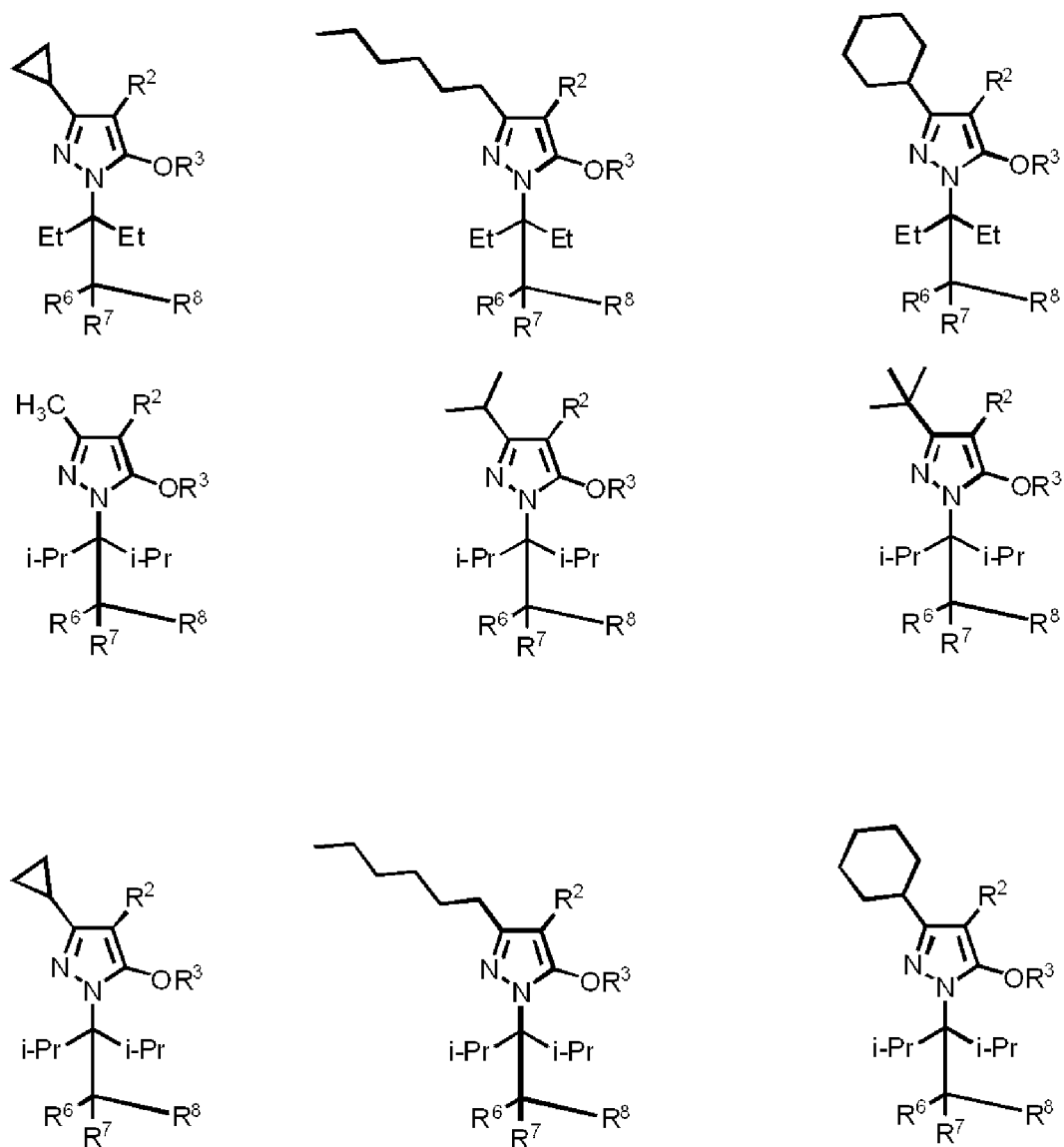
[0120]

[化32]



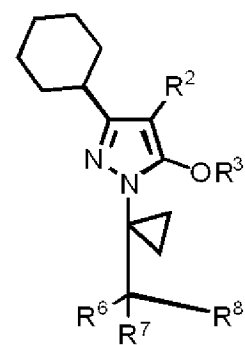
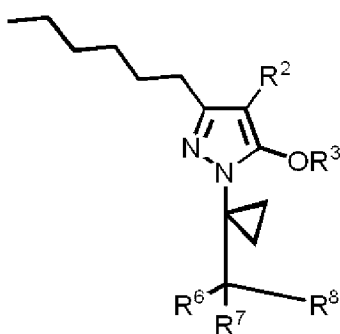
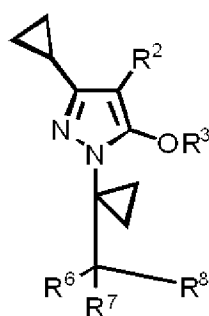
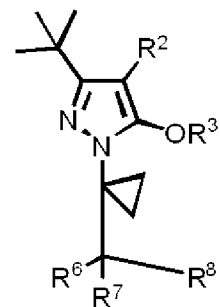
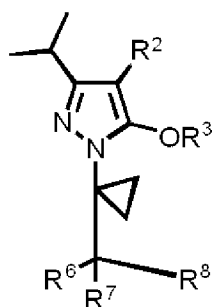
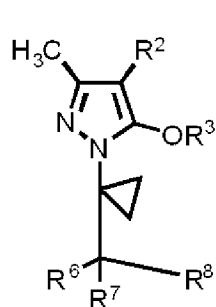
[0121]

[化33]



[0122]

[化34]



[0123]

R ²	(Z) _m on ring of R ²	R ⁸	(Z) _m on ring of R ⁸	R ³	R ⁶	R ⁷
H	-	c-Pr	-	H	H	H
CH ₃	-	c-Pr	-	H	H	H
H	-	c-Bu	-	H	H	H
CH ₃	-	c-Bu	-	H	H	H
H	-	c-Pen	-	H	H	H
CH ₃	-	c-Pen	-	H	H	H
H	-	c-Hex	-	H	H	H
CH ₃	-	c-Hex	-	H	H	H
CH ₃	-	c-Hex	-	CH ₃	H	H

CH ₃	-	c-Hex	-	CH ₂ Ph	H	H
CH ₃	-	c-Hex	-	C(=O)Ph	H	H
CH ₃	-	c-Hex	-	C(=O)OEt	H	H
CH ₃	-	c-Hex	-	H	H	CH ₃
CH ₃	-	c-Hex	-	H	CH ₃	CH ₃
C(=O)CH ₃	-	c-Pr	-	H	H	H
C(=O)CH ₃	-	c-Hex	-	H	H	H
C(=O)CH ₃	-	c-Hex	-	CH ₃	H	H
C(=O)CH ₃	-	c-Hex	-	CH ₂ Ph	H	H
C(=O)CH ₃	-	c-Hex	-	C(=O)Ph	H	H
C(=O)CH ₃	-	c-Hex	-	C(=O)OEt	H	H
C(=O)CH ₃	-	c-Hex	-	H	H	CH ₃
C(=O)CH ₃	-	c-Hex	-	H	CH ₃	CH ₃
C(=O)Ph	-	c-Pr	-	H	H	H
C(=O)Ph	-	c-Hex	-	H	H	H
C(=O)Ph	-	c-Hex	-	CH ₃	H	H
C(=O)Ph	-	c-Hex	-	CH ₂ Ph	H	H
C(=O)Ph	-	c-Hex	-	C(=O)Ph	H	H
C(=O)Ph	-	c-Hex	-	C(=O)OEt	H	H
C(=O)Ph	-	c-Hex	-	H	H	CH ₃
C(=O)Ph	-	c-Hex	-	H	CH ₃	CH ₃
A005	H	A005	H	H	H	H
A005	H	A006	H	H	H	H
A005	H	A014	H	H	H	H
A005	H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
A005	H	A037	H	H	H	H
A005	H	A038	H	H	H	H
A005	H	A041	H	H	H	H

A005	H	A042	H	H	H	H
A005	H	A043	H	H	H	H
A005	H	A044	H	H	H	H
A006	H	A005	H	H	H	H
A006	H	A006	H	H	H	H
A006	H	A006	H	CH ₃	H	H
A006	H	A006	H	CH ₂ Ph	H	H
A006	H	A006	H	C(O)Ph	H	H

[0124] 第5表 (続き)

R ²	(Z) _m on ring of R ²	R ⁸	(Z) _m on ring of R ⁸	R ³	R ⁶	R ⁷
A006	H	A006	H	H	H	CH ₃
A006	H	A006	H	H	CH ₃	CH ₃
A006	H	A014	H	H	H	H
A006	H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	CH	H	H
A006	H	A037	H	H	H	H
A006	H	A037	H	CH ₃	H	H
A006	H	A037	H	CH ₂ Ph	H	H
A006	H	A037	H	C(O)Ph	H	H
A006	H	A037	H	H	H	CH ₃
A006	H	A037	H	H	CH ₃	CH ₃
A006	H	A038	H	H	H	H
A006	H	A038	H	CH ₃	H	H
A006	H	A038	H	CH ₂ Ph	H	H
A006	H	A038	H	C(O)Ph	H	H
A006	H	A038	H	H	H	CH ₃

A006	H	A038	H	H	CH ₃	CH ₃
A006	H	A041	H	H	H	H
A006	H	A041	H	CH ₃	H	H
A006	H	A041	H	CH ₂ Ph	H	H
A006	H	A041	H	C(O)Ph	H	H
A006	H	A041	H	H	H	CH ₃
A006	H	A041	H	H	CH ₃	CH ₃
A006	H	A042	H	H	H	H
A006	H	A042	H	CH ₃	H	H
A006	H	A042	H	CH ₂ Ph	H	H
A006	H	A042	H	C(O)Ph	H	H
A006	H	A042	H	H	H	CH ₃
A006	H	A042	H	H	CH ₃	CH ₃
A006	H	A043	H	H	H	H
A006	H	A044	H	H	H	H
A014	H	A005	H	H	H	H
A014	H	A006	H	H	H	H
A014	H	A014	H	H	H	H
A014	H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
A014	H	A037	H	H	H	H
A014	H	A038	H	H	H	H
A014	H	A041	H	H	H	H
A014	H	A042	H	H	H	H
A014	H	A043	H	H	H	H
A014	H	A044	H	H	H	H
A016	2, 4-(CH ₃) ₂	A005	H	H	H	H
A016	2, 4-(CH ₃) ₂	A006	H	H	H	H
A016	2, 4-(CH ₃) ₂	A014	H	H	H	H

A016 2,4-(CH₃)₂ A016 2,4-(CH₃)₂ H H H

[0125] 第5表 (続き)

R ²	(Z) _m on ring of R ²	R ⁸	(Z) _m on ring of R ⁸	R ³	R ⁶	R ⁷
A016	2,4-(CH ₃) ₂	A037	H	H	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	A038	H	H	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	A041	H	H	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	A042	H	H	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	A043	H	H	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	A044	H	H	H	H
A036	H	A005	H	H	H	H
A036	H	A006	H	H	H	H
A036	H	A014	H	H	H	H
A036	H	A016	2,4-(CH ₃) ₂	H	H	H
A036	H	A037	H	H	H	H
A036	H	A038	H	H	H	H
A036	H	A041	H	H	H	H
A036	H	A042	H	H	H	H
A036	H	A043	H	H	H	H
A036	H	A044	H	H	H	H
A037	H	A005	H	H	H	H
A037	H	A006	H	H	H	H
A037	H	A006	H	CH ₃	H	H
A037	H	A006	H	CH ₂ Ph	H	H
A037	H	A006	H	C(O)Ph	H	H
A037	H	A006	H	H	H	CH ₃

A037	H	A006	H	H	CH ₃	CH ₃
A037	H	A014	H	H	H	H
A037	H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
A037	H	A037	H	H	H	H
A037	H	A037	H	CH ₃	H	H
A037	H	A037	H	CH ₂ Ph	H	H
A037	H	A037	H	C(O)Ph	H	H
A037	H	A037	H	H	H	CH ₃
A037	H	A037	H	H	CH ₃	CH ₃
A037	H	A038	H	H	H	H
A037	H	A038	H	CH ₃	H	H
A037	H	A038	H	CH ₂ Ph	H	H
A037	H	A038	H	C(O)Ph	H	H
A037	H	A038	H	H	H	CH ₃
A037	H	A038	H	H	CH ₃	CH ₃
A037	H	A041	H	H	H	H
A037	H	A041	H	CH ₃	H	H
A037	H	A041	H	CH ₂ Ph	H	H
A037	H	A041	H	C(O)Ph	H	H
A037	H	A041	H	H	H	CH ₃
A037	H	A041	H	H	CH ₃	CH ₃
A037	H	A042	H	H	H	H

[0126] 第5表 (続き)

R ²	(Z) _m	R ⁸	(Z) _m	R ³	R ⁶	R ⁷
	on ring of R ²		on ring of R ⁸			
A037	H	A042	H	CH ₃	H	H

A037	H	A042	H	CH ₂ Ph	H	H
A037	H	A042	H	C(O)Ph	H	H
A037	H	A042	H	H	H	CH ₃
A037	H	A042	H	H	CH ₃	CH ₃
A037	H	A043	H	H	H	H
A037	H	A044	H	H	H	H
A038	H	A005	H	H	H	H
A038	H	A006	H	H	H	H
A038	H	A006	H	CH ₃	H	H
A038	H	A006	H	CH ₂ Ph	H	H
A038	H	A006	H	C(O)Ph	H	H
A038	H	A006	H	H	H	CH ₃
A038	H	A006	H	H	CH ₃	CH ₃
A038	H	A014	H	H	H	H
A038	H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
A038	H	A037	H	H	H	H
A038	H	A037	H	CH ₃	H	H
A038	H	A037	H	CH ₂ Ph	H	H
A038	H	A037	H	C(O)Ph	H	H
A038	H	A037	H	H	H	CH ₃
A038	H	A037	H	H	CH ₃	CH ₃
A038	H	A038	H	H	H	H
A038	H	A038	H	CH ₃	H	H
A038	H	A038	H	CH ₂ Ph	H	H
A038	H	A038	H	C(O)Ph	H	H
A038	H	A038	H	H	H	CH ₃
A038	H	A038	H	H	CH ₃	CH ₃
A038	H	A041	H	H	H	H

A038	H	A041	H	CH ₃	H	H
A038	H	A041	H	CH ₂ Ph	H	H
A038	H	A041	H	C(O)Ph	H	H
A038	H	A041	H	H	H	CH ₃
A038	H	A041	H	H	CH ₃	CH ₃
A038	H	A042	H	H	H	H
A038	H	A042	H	CH ₃	H	H
A038	H	A042	H	CH ₂ Ph	H	H
A038	H	A042	H	C(O)Ph	H	H
A038	H	A042	H	H	H	CH ₃
A038	H	A042	H	H	CH ₃	CH ₃
A038	H	A043	H	H	H	H
A038	H	A044	H	H	H	H
A041	H	A005	H	H	H	H
A041	H	A006	H	H	H	H

[0127] 第5表 (続き)

R ²	(Z) _m on ring of R ²	R ⁸	(Z) _m on ring of R ⁸	R ³	R ⁶	R ⁷
A041	H	A006	H	CH ₃	H	H
A041	H	A006	H	CH ₂ Ph	H	H
A041	H	A006	H	C(O)Ph	H	H
A041	H	A006	H	H	H	CH ₃
A041	H	A006	H	H	CH ₃	CH ₃
A041	H	A014	H	H	H	H
A041	H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
A041	H	A037	H	H	H	H

A041	H	A037	H	CH ₃	H	H
A041	H	A037	H	CH ₂ Ph	H	H
A041	H	A037	H	C(O)Ph	H	H
A041	H	A037	H	H	H	CH ₃
A041	H	A037	H	H	CH ₃	CH ₃
A041	H	A038	H	H	H	H
A041	H	A038	H	CH ₃	H	H
A041	H	A038	H	CH ₂ Ph	H	H
A041	H	A038	H	C(O)Ph	H	H
A041	H	A038	H	H	H	CH ₃
A041	H	A038	H	H	CH ₃	CH ₃
A041	H	A041	H	H	H	H
A041	H	A041	H	CH ₃	H	H
A041	H	A041	H	CH ₂ Ph	H	H
A041	H	A041	H	C(O)Ph	H	H
A041	H	A041	H	H	H	CH ₃
A041	H	A041	H	H	CH ₃	CH ₃
A041	H	A042	H	H	H	H
A041	H	A042	H	CH ₃	H	H
A041	H	A042	H	CH ₂ Ph	H	H
A041	H	A042	H	C(O)Ph	H	H
A041	H	A042	H	H	H	CH ₃
A041	H	A042	H	H	CH ₃	CH ₃
A041	H	A043	H	H	H	H
A041	H	A044	H	H	H	H
A042	H	A005	H	H	H	H
A042	H	A006	H	H	H	H
A042	H	A006	H	CH ₃	H	H

A042	H	A006	H	CH ₂ Ph	H	H
A042	H	A006	H	C(O)Ph	H	H
A042	H	A006	H	H	H	CH ₃
A042	H	A006	H	H	CH ₃	CH ₃
A042	H	A014	H	H	H	H
A042	H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
A042	H	A037	H	H	H	H
A042	H	A037	H	CH ₃	H	H

[0128] 第5表 (続き)

R ²	(Z) _m on ring of R ²	R ⁸	(Z) _m on ring of R ⁸	R ³	R ⁶	R ⁷
A042	H	A037	H	CH ₂ Ph	H	H
A042	H	A037	H	C(O)Ph	H	H
A042	H	A037	H	H	H	CH ₃
A042	H	A037	H	H	CH ₃	CH ₃
A042	H	A038	H	H	H	H
A042	H	A038	H	CH ₃	H	H
A042	H	A038	H	CH ₂ Ph	H	H
A042	H	A038	H	C(O)Ph	H	H
A042	H	A038	H	H	H	CH ₃
A042	H	A038	H	H	CH ₃	CH ₃
A042	H	A041	H	H	H	H
A042	H	A041	H	CH ₃	H	H
A042	H	A041	H	CH ₂ Ph	H	H
A042	H	A041	H	C(O)Ph	H	H
A042	H	A041	H	H	H	CH ₃

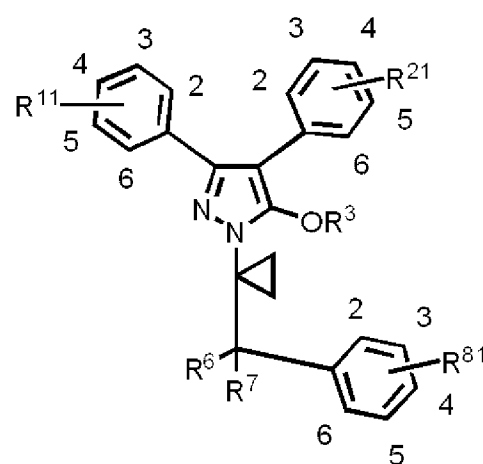
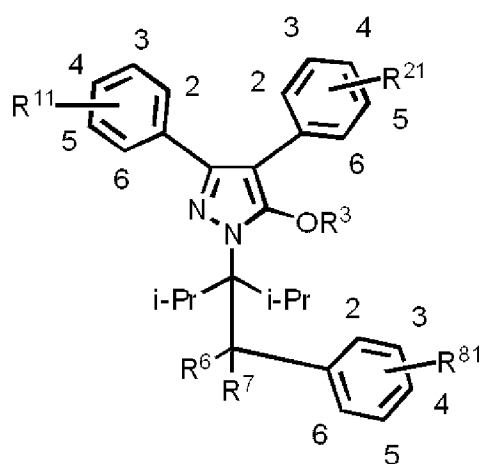
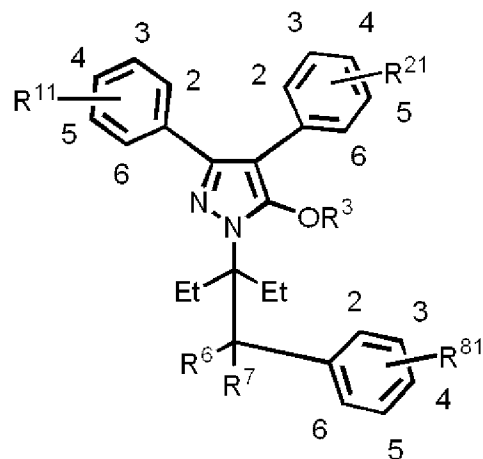
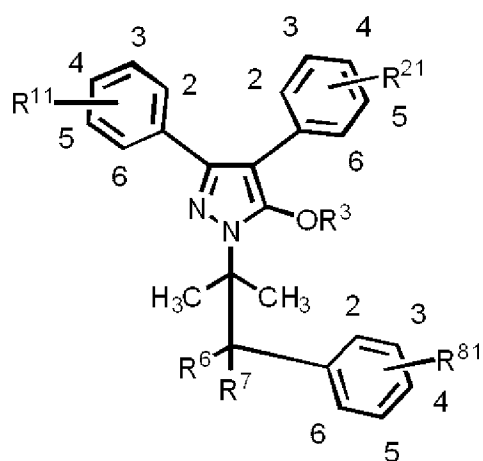
A042	H	A041	H	H	CH ₃	CH ₃
A042	H	A042	H	H	H	H
A042	H	A042	H	CH ₃	H	H
A042	H	A042	H	CH ₂ Ph	H	H
A042	H	A042	H	C(O)Ph	H	H
A042	H	A042	H	H	H	CH ₃
A042	H	A042	H	H	CH ₃	CH ₃
A042	H	A043	H	H	H	H
A042	H	A044	H	H	H	H

第 6 表

表中、置換基R¹¹、R²¹及びR⁸¹の置換位置を表す番号は、それぞれ下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものである。

[0129]

[化35]



[0130]

R ¹¹	R ²¹	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
H	H	H	H	H	H
H	4-CH ₃	H	H	H	H
H	4-t-Bu	H	H	H	H
H	4-t-Bu	4-CH ₃	H	H	H
H	4-t-Bu	H	CH ₃	H	H
H	4-t-Bu	4-CH ₃	CH ₃	H	H
H	4-n-Hex	H	H	H	H
H	4-n-Hex	4-Cl	H	H	H

H	4-n-Hex	4-Br	H	H	H
H	4-n-Hex	4-CH ₃	H	H	H
H	4-n-Hex	H	CH ₃	H	H
H	4-n-Hex	4-CH ₃	CH ₃	H	H
H	4-n-Hex	H	CH ₂ Ph	H	H
H	4-n-Hex	H	C(O)OEt	H	H
H	4-n-Hex	H	C(O)Ph	H	H
H	4-n-Hex	H	H	H	CH ₃
H	4-n-Hex	H	H	CH ₃	CH ₃
H	4-Ph	H	H	H	H
H	4-Ph	4-CH ₃	H	H	H
H	4-Ph	H	CH ₃	H	H
H	4-Ph	4-CH ₃	CH ₃	H	H
4-F	H	H	H	H	H
2-Cl	H	H	H	H	H
3-Cl	H	H	H	H	H
4-Cl	H	H	H	H	H
4-Cl	4-t-Bu	H	H	H	H
4-Cl	4-t-Bu	4-CH ₃	H	H	H
4-Cl	4-n-Hex	H	H	H	H
4-Cl	4-n-Hex	4-Cl	H	H	H
4-Cl	4-n-Hex	4-Br	H	H	H
4-Cl	4-n-Hex	4-CH ₃	H	H	H
4-Cl	4-Ph	H	H	H	H
4-Cl	4-Ph	4-CH ₃	H	H	H
4-Br	H	H	H	H	H
3,4-Cl ₂	H	H	H	H	H
4-NO ₃	H	H	H	H	H

4-CN	H	H	H	H	H
2-CH ₃	H	H	H	H	H
3-CH ₃	H	H	H	H	H
4-CH ₃	H	H	H	H	H
4-CH ₃	4-t-Bu	H	H	H	H
4-CH ₃	4-t-Bu	4-CH ₃	H	H	H
4-CH ₃	4-n-Hex	H	H	H	H
4-CH ₃	4-n-Hex	4-Cl	H	H	H
4-CH ₃	4-n-Hex	4-Br	H	H	H
4-CH ₃	4-n-Hex	4-CH ₃	H	H	H

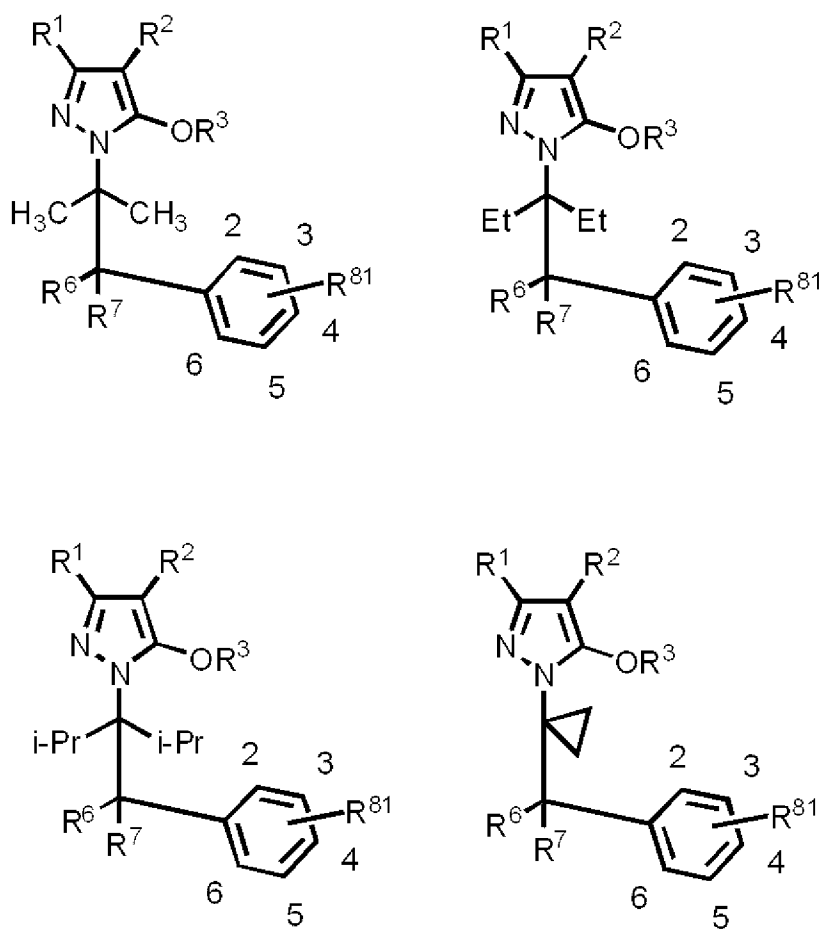
[0131] 第6表 (続き)

R ¹¹	R ²¹	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
4-CH ₃	4-Ph	H	H	H	H
4-CH ₃	4-Ph	4-CH ₃	H	H	H
3,4-(CH ₃) ₂	H	H	H	H	H
4-OCH ₃	H	H	H	H	H
4-OCH ₃	4-t-Bu	H	H	H	H
4-OCH ₃	4-n-Hex	H	H	H	H
4-OCH ₃	4-n-Hex	4-Cl	H	H	H
4-OCH ₃	4-n-Hex	4-Br	H	H	H
4-OCH ₃	4-n-Hex	4-CH ₃	H	H	H
4-OCH ₃	4-Ph	H	H	H	H
3,4-(OCH ₃)	H	H	H	H	H
4-Ph	H	H	H	H	H

第7表

表中、置換基 R^{81} の置換位置を表す番号は、それぞれ下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものであり、一の表記は、無置換を表す。

[0132] [化36]



[0133] -----

R^1	R^2	(Z) _m	R^{81}	R^3	R^6	R^7
H	H	—	H	H	H	H
Et	H	—	H	H	H	H
n-Pr	H	—	H	H	H	H
n-Bu	H	—	H	H	H	H
c-Bu	H	—	H	H	H	H
n-Pen	H	—	H	H	H	H
c-Pen	H	—	H	H	H	H

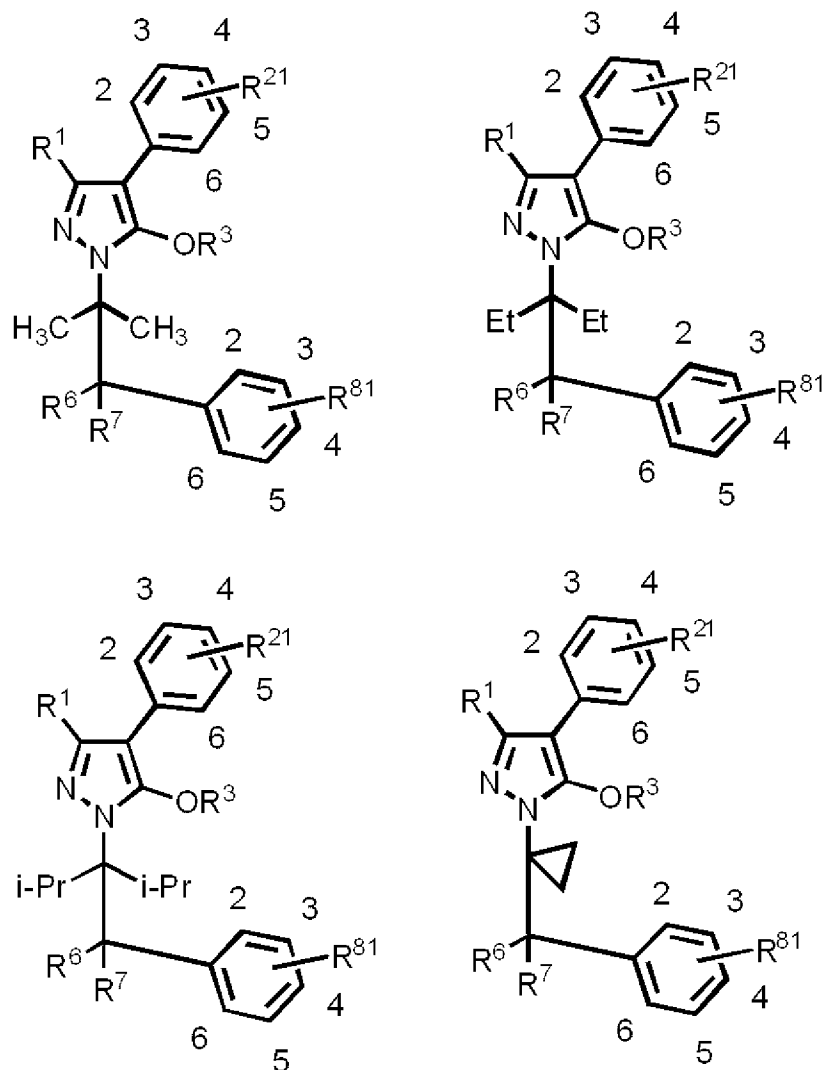
CF ₃	H	—	H	H	H	H
CF ₃	H	—	4-CH ₃	H	H	H
CF ₃	H	—	4-CH ₃	CH ₃	H	H
CF ₃	A005	—	H	H	H	H
CF ₃	A006	—	H	H	H	H
CF ₃	A014		H	H	H	H
CF ₃	A016	2,4-(CH ₃) ₂	H	H	H	H
CF ₃	A036	H	H	H	H	H
CF ₃	A037	—	H	H	H	H
CF ₃	A038	—	H	H	H	H
CF ₃	A041	—	H	H	H	H
CF ₃	A042	—	H	H	H	H
CN	H	—	H	H	H	H
C(O)OEt	H	—	H	H	H	H
Ph	H	—	H	H	H	H
(4-CH ₃)Ph	H	—	H	H	H	H
(4-i-Pr)Ph	H	—	H	H	H	H
(4-OCH ₃)Ph	H	—	H	H	H	H
(4-OCH ₃)Ph	H	—	4-CH ₃	H	H	H

第8表

表中、置換基R²¹及びR⁸¹の置換位置を表す番号は、それぞれ下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものであり、—の表記は、無置換を表す。

[0134]

[化37]



[0135]

R^1	(Z)m	R^{21}	R^{81}	R^3	R^6	R^7
H	-	H	H	H	H	H
Et	-	H	H	H	H	H
n-Pr	-	H	H	H	H	H
n-Bu	-	H	H	H	H	H
CF_3	-	H	H	H	H	H
CF_3	-	4- CH_3	H	H	H	H
CF_3	-	4- CH_3	4- CH_3	H	H	H

CF ₃	—	4-CH ₃	4-CH ₃	CH ₃	H	H
CF ₃	—	4-CH ₃	4-CH ₃	H	H	CH ₃
CF ₃	—	4-t-Bu	H	H	H	H
CF ₃	—	4-n-Hex	4-CH ₃	H	H	H
CF ₃	—	4-n-Hex	4-CH ₃	CH ₃	H	H
CF ₃	—	4-n-Hex	4-CH ₃	H	H	CH ₃
CF ₃	—	4-n-Hex	4-CH ₃	H	CH ₃	CH ₃
CF ₃	—	4-Ph	H	H	H	H
CO ₂ Et	—	H	H	H	H	H
A001	H	H	H	H	H	H
A002	H	H	H	H	H	H
A003	H	H	H	H	H	H
A005	H	H	H	H	H	H
A005	2, 5-(CH ₃) ₂	H	H	H	H	H
A005	2, 5-Cl ₂	H	H	H	H	H
A005	2-Br	H	H	H	H	H
A006	H	H	H	H	H	H
A006	3-CH ₃	H	H	H	H	H
A006	5-CH ₃	H	H	H	H	H
A006	3-Cl	H	H	H	H	H
A006	5-Et	H	H	H	H	H
A006	5-Cl	H	H	H	H	H
A006	5-Br	H	H	H	H	H
A006	3-Br	H	H	H	H	H
A006	4-Br	H	H	H	H	H
A006	5-NO ₂	H	H	H	H	H
A007	H	H	H	H	H	H
A007	5-CH ₃	H	H	H	H	H

A007	3-CH ₃	H	H	H	H	H
A007	5-Br	H	H	H	H	H
A007	5-NO ₂	H	H	H	H	H
A007	5-Ph	H	H	H	H	H
A008	5-CH ₃	H	H	H	H	H
A009	5-CH ₃	H	H	H	H	H
A010	3, 5-(CH ₃) ₂	H	H	H	H	H
A010	3, 5-Cl ₂	H	H	H	H	H
A011	3, 5-(CH ₃) ₂	H	H	H	H	H
A011	3, 5-Cl ₂	H	H	H	H	H
A012	3-CH ₃	H	H	H	H	H

[0136] 第8表 (続き)

R ¹	(Z) _m	R ²¹	R ⁸¹	R ³	R ⁶	R ⁷
A012	3-CH ₃	H	H	H	H	H
A012	3-Cl	H	H	H	H	H
A013	3-CH ₃	H	H	H	H	H
A013	3-CH ₃	H	H	H	H	H
A013	3-Cl	H	H	H	H	H
A014	H	H	H	H	H	H
A015	H	H	H	H	H	H
A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H	H	H
A017	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H	H	H
A034	H	H	H	H	H	H
A034	3, 6-Cl ₂	H	H	H	H	H
A035	H	H	H	H	H	H
A036	H	H	H	H	H	H

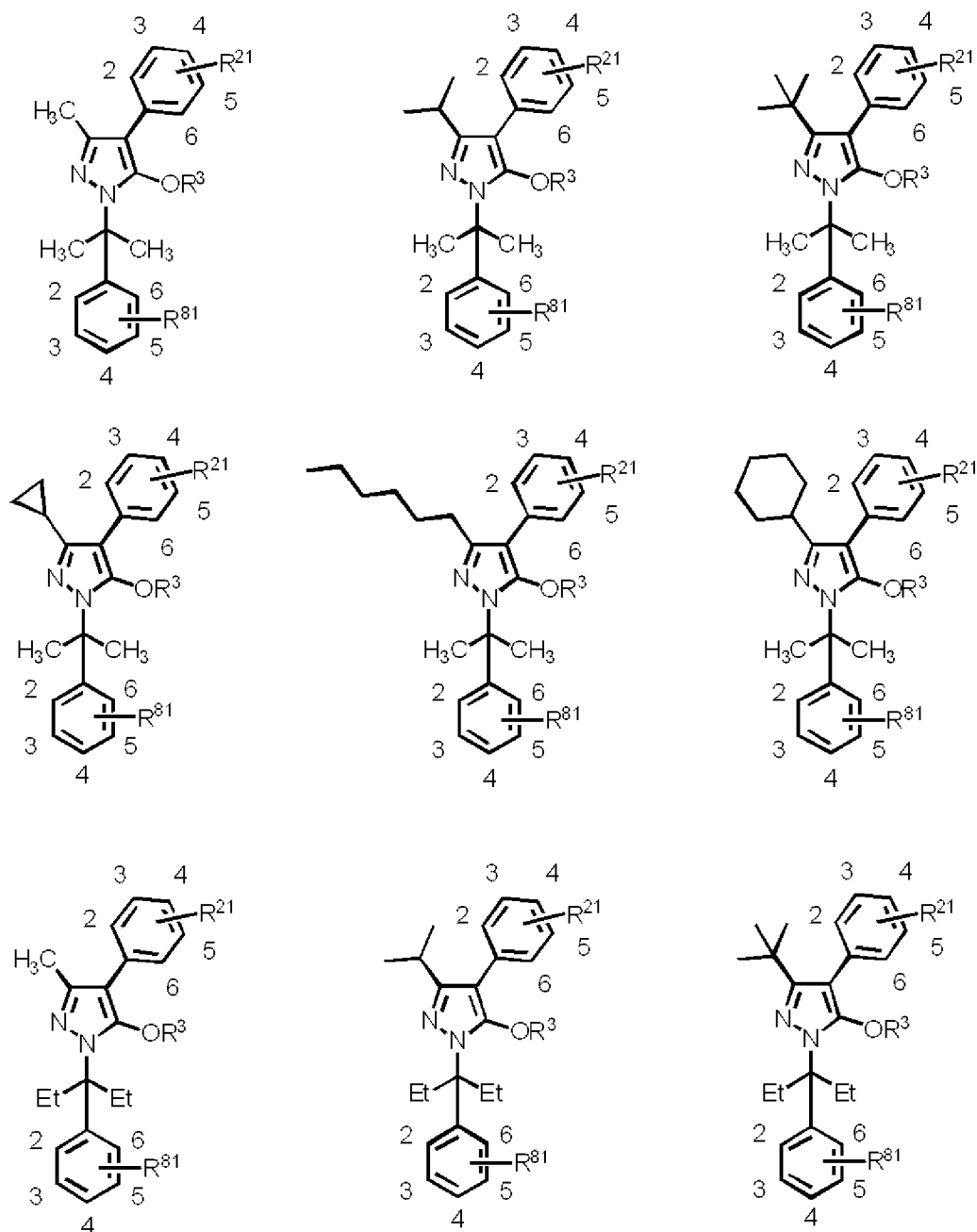
A037	H	H	H	H	H	H
A037	6-OCH ₃	H	H	H	H	H
A037	6-Br	H	H	H	H	H
A038	H	H	H	H	H	H
A038	2-OCH ₃	H	H	H	H	H
A038	4-OCH ₃	H	H	H	H	H
A038	4-F	H	H	H	H	H

第9表

表中、置換基R²¹及びR⁸¹の置換位置を表す番号は、それぞれ下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものである。

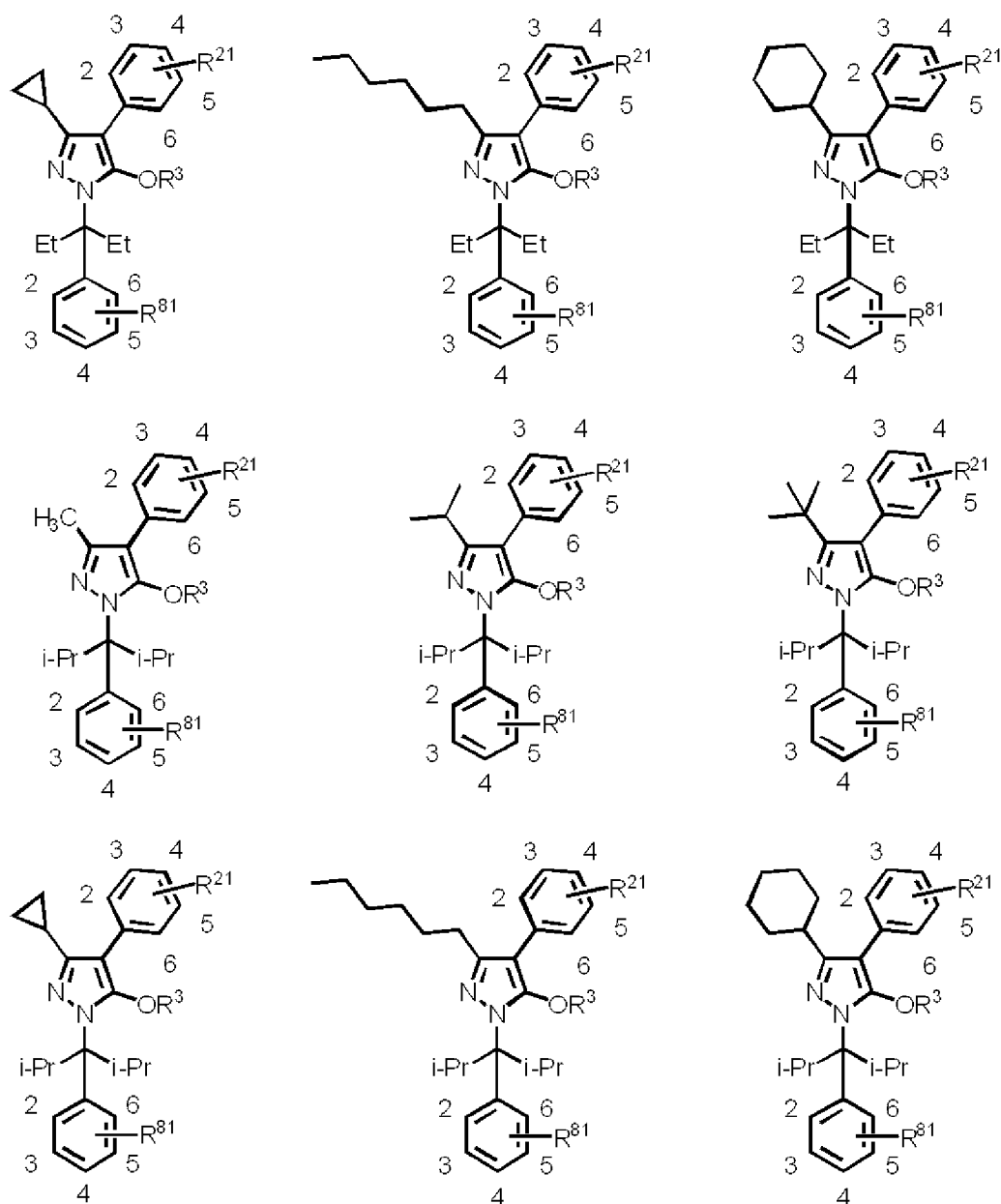
[0137]

[化38]



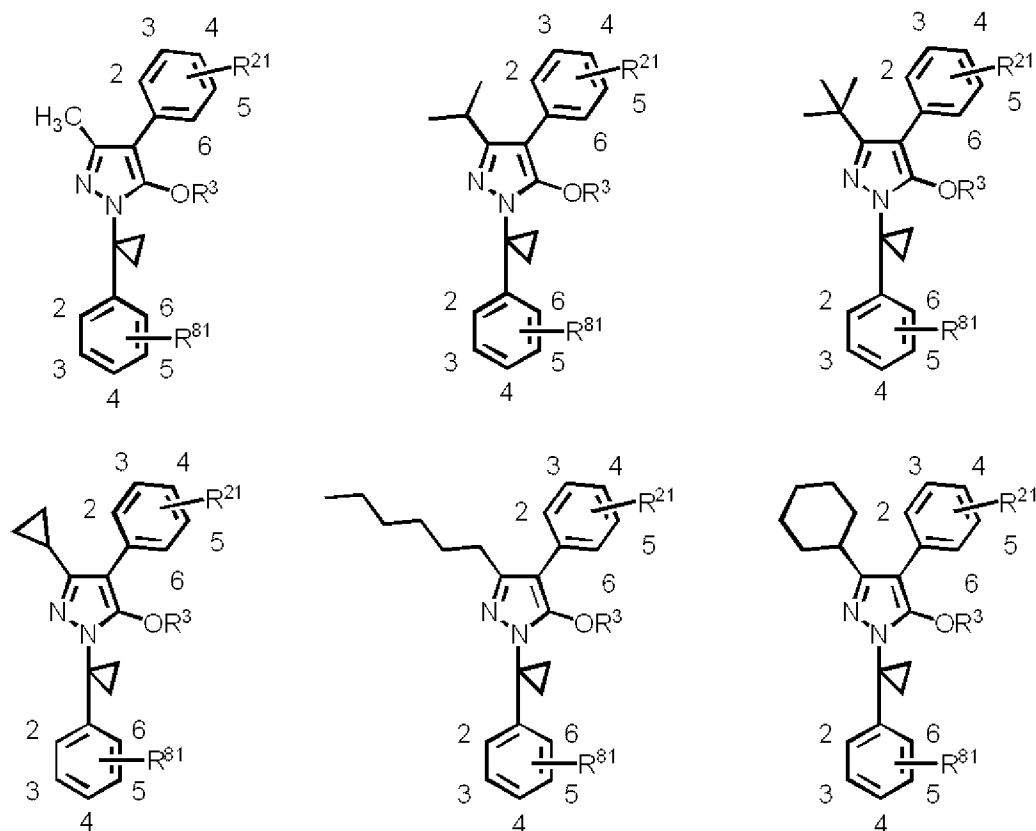
[0138]

[化39]



[0139]

[化40]



[0140]

R ²¹	R ⁸¹	R ³
H	H	H
H	4-F	H
H	2-Cl	H
H	3-Cl	H
H	4-Cl	H
H	4-Cl	CH ₃
H	4-Cl	CH ₂ Ph
H	4-Cl	C(O)Ph
H	4-Cl	C(O)OEt
H	4-Br	H
H	4-I	H

H	2, 4-Cl ₂	H
H	3, 4-Cl ₂	H
H	4-NO ₂	H
H	4-CN	H
H	2-CH ₃	H
H	3-CH ₃	H
H	4-CH ₃	H
H	4-CH ₃	CH ₃
H	4-CH ₃	CH ₂ Ph
H	4-CH ₃	C(0)Ph
H	4-CH ₃	C(0)OEt
H	4-Et	H
H	4-n-Pr	H
H	4-c-Pr	H
H	4-i-Pr	H
H	4-n-Bu	H
H	4-c-Bu	H
H	4-i-Bu	H
H	4-t-Bu	H
H	4-t-Bu	CH ₃
H	4-t-Bu	CH ₂ Ph
H	4-t-Bu	C(0)Ph
H	4-t-Bu	C(0)OEt
H	4-n-Pen	H
H	4-c-Pen	H
H	4-n-Hex	H
H	4-n-Hex	CH ₃
H	4-n-Hex	CH ₂ Ph

H	4-n-Hex	C(0)Ph
H	4-n-Hex	C(0)OEt
H	4-c-Hex	H
H	4-n-C ₇ H ₁₅	H
H	4-n-C ₈ H ₁₇	H
H	4-n-C ₉ H ₁₉	H
H	4-n-C ₁₀ H ₂₁	H

[0141] 第9表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³
H	2, 4-(CH ₃)	H
H	3, 4-(CH ₃) ₂	H
H	4-CF ₃	H
H	4-OH	H
H	2-OCH ₃	H
H	3-OCH ₃	H
H	4-OCH ₃	H
H	4-O-n-Hex	H
H	4-O-c-Hex	H
H	2, 4-(OCH ₃) ₂	H
H	3, 4-(OCH ₃) ₂	H
H	4-OCH ₂ OCH ₃	H
H	4-OC ₂ H ₄ OEt	H
H	4-OCF ₃	H
H	4-OPh	H
H	4-OCH ₂ Ph	H
H	4-C(CH ₃)=NCH ₃	H

H	4-C(CH ₃)=NPh	H
H	4-C(Ph)=NCH ₃	H
H	4-C(Ph)=NPh	H
H	4-C(CH ₃)=NOCH ₃	H
H	4-C(CH ₃)=NOPh	H
H	4-C(Ph)=NOCH ₃	H
H	4-C(Ph)=NOPh	H
H	4-C(O)CH ₃	H
H	4-C(O)CF ₃	H
H	4-C(O)Ph	H
H	4-C(O)OCH ₃	H
H	2-C(O)OEt	H
H	3-C(O)OEt	H
H	4-C(O)OEt	H
H	4-C(O)OPh	H
H	4-C(O)OCH ₂ Ph	H
H	4-C(O)OCH(CH ₃)Ph	H
H	4-C(O)OC ₂ H ₄ Ph	H
H	4-SCH ₃	H
H	4-S(O)CH ₃	H
H	4-S(O) ₂ CH ₃	H
H	4-SPh	H
H	4-S(O)Ph	H
H	4-S(O) ₂ Ph	H
H	4-OS(O) ₂ CH ₃	H
H	4-OS(O) ₂ Ph	H
H	4-N(CH ₃) ₂	H
H	4-N(CH ₂ Ph) ₂	H

[0142] 第9表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³
H	4-N(CH ₃)(CH ₂ Ph)	H
H	4-NHCH ₃	H
H	4-NH(CH ₂ Ph)	H
H	4-C(O)N(CH ₃) ₂	H
H	4-C(O)N(CH ₂ Ph) ₂	H
H	4-C(O)N(CH ₃)(CH ₂ Ph)	H
H	4-C(O)NHCH ₃	H
H	4-C(O)NH(CH ₂ Ph)	H
H	4-C(O)NH(CH(CH ₃)Ph)	H
H	4-C(O)NH(C ₂ H ₄ Ph)	H
H	4-C(S)NH ₂	H
H	4-S(O) ₂ N(CH ₃) ₂	H
H	4-S(O) ₂ N(CH ₂ Ph) ₂	H
H	4-S(O) ₂ N(CH ₃)(CH ₂ Ph)	H
H	4-S(O) ₂ NHCH ₃	H
H	4-S(O) ₂ NHPh	H
H	4-S(O) ₂ NH(CH ₂ Ph)	H
H	4-S(O) ₂ NH{CH(CH ₃)Ph}	H
H	4-S(O) ₂ NH(C ₂ H ₄ Ph)	H
H	4-Ph	H
H	4-Ph	CH ₃
H	4-Ph	CH ₂ Ph
H	4-Ph	C(O)Ph
H	4-Ph	C(O)OEt

4-F	H	H
4-F	4-Cl	H
4-F	4-Br	H
4-F	4-CH ₃	H
4-F	4-t-Bu	H
4-F	4-n-Hex	H
4-F	4-Ph	H
2-Cl	H	H
2-Cl	4-Cl	H
2-Cl	4-Br	H
2-Cl	4-CH ₃	H
2-Cl	4-t-Bu	H
2-Cl	4-n-Hex	H
2-Cl	4-Ph	H
3-Cl	H	H
3-Cl	4-Cl	H
3-Cl	4-Br	H
3-Cl	4-CH ₃	H
3-Cl	4-t-Bu	H
3-Cl	4-n-Hex	H
3-Cl	4-Ph	H

[0143] 第9表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³
4-Cl	H	H
4-Cl	4-Cl	H
4-Cl	4-Br	H

4-Cl	4-CH ₃	H
4-Cl	4-t-Bu	H
4-Cl	4-t-Bu	CH ₃
4-Cl	4-n-Hex	H
4-Cl	4-n-Hex	CH ₃
4-Cl	4-Ph	H
4-Cl	4-Ph	CH ₃
4-Br	H	H
4-Br	4-Cl	H
4-Br	4-Br	H
4-Br	4-CH ₃	H
4-Br	4-t-Bu	H
4-Br	4-n-Hex	H
4-Br	4-Ph	H
3,4-Cl ₂	H	H
3,4-Cl ₂	4-Cl	H
3,4-Cl ₂	4-Br	H
3,4-Cl ₂	4-CH ₃	H
3,4-Cl ₂	4-t-Bu	H
3,4-Cl ₂	4-n-Hex	H
3,4-Cl ₂	4-Ph	H
4-NO ₂	H	H
4-NO ₂	4-Cl	H
4-NO ₂	4-Br	H
4-NO ₂	4-CH ₃	H
4-NO ₂	4-t-Bu	H
4-NO ₂	4-n-Hex	H
4-NO ₂	4-Ph	H

4-CN	H	H
4-CN	4-Cl	H
4-CN	4-Br	H
4-CN	4-CH ₃	H
4-CN	4-t-Bu	H
4-CN	4-n-Hex	H
4-CN	4-Ph	H
2-CH ₃	H	H
2-CH ₃	4-Cl	H
2-CH ₃	4-Br	H
2-CH ₃	4-CH ₃	H
2-CH ₃	4-t-Bu	H
2-CH ₃	4-n-Hex	H
2-CH ₃	4-Ph	H

[0144] 第9表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³
3-CH ₃	H	H
3-CH ₃	4-Cl	H
3-CH ₃	4-Br	H
3-CH ₃	4-CH ₃	H
3-CH ₃	4-t-Bu	H
3-CH ₃	4-n-Hex	H
3-CH ₃	4-Ph	H
4-CH ₃	H	H
4-CH ₃	4-Cl	H
4-CH ₃	4-Br	H

4-CH ₃	4-CH ₃	H
4-CH ₃	4-t-Bu	H
4-CH ₃	4-t-Bu	CH ₃
4-CH ₃	4-n-Hex	H
4-CH ₃	4-n-Hex	CH ₃
4-CH ₃	4-Ph	H
4-CH ₃	4-Ph	CH ₃
4-c-Pr	H	H
4-c-Pr	4-Cl	H
4-c-Pr	4-Br	H
4-c-Pr	4-CH ₃	H
4-c-Pr	4-t-Bu	H
4-c-Pr	4-n-Hex	H
4-c-Pr	4-Ph	H
4-i-Pr	H	H
4-i-Pr	4-Cl	H
4-i-Pr	4-Br	H
4-i-Pr	4-CH ₃	H
4-i-Pr	4-t-Bu	H
4-i-Pr	4-n-Hex	H
4-i-Pr	4-Ph	H
4-t-Bu	H	H
4-t-Bu	4-Cl	H
4-t-Bu	4-Br	H
4-t-Bu	4-CH ₃	H
4-t-Bu	4-t-Bu	H
4-t-Bu	4-t-Bu	CH ₃
4-t-Bu	4-n-Hex	H

4-t-Bu	4-n-Hex	CH ₃
4-t-Bu	4-Ph	H
4-t-Bu	4-Ph	CH ₃
4-n-Hex	H	H
4-n-Hex	H	CH ₃
4-n-Hex	H	CH ₂ Ph
4-n-Hex	H	C(O)Ph

[0145] 第9表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³
4-n-Hex	H	C(O)OEt
4-n-Hex	4-F	H
4-n-Hex	2-Cl	H
4-n-Hex	3-Cl	H
4-n-Hex	4-Cl	H
4-n-Hex	4-Cl	CH ₃
4-n-Hex	4-Cl	CH ₂ Ph
4-n-Hex	4-Cl	C(O)Ph
4-n-Hex	4-Cl	C(O)OEt
4-n-Hex	4-Br	H
4-n-Hex	4-I	H
4-n-Hex	2,4-Cl ₂	H
4-n-Hex	3,4-Cl ₂	H
4-n-Hex	4-NO ₂	H
4-n-Hex	4-CN	H
4-n-Hex	2-CH ₃	H
4-n-Hex	3-CH ₃	H

4-n-Hex	4-CH ₃	H
4-n-Hex	4-CH ₃	CH ₃
4-n-Hex	4-CH ₃	CH ₂ Ph
4-n-Hex	4-CH ₃	C(0)Ph
4-n-Hex	4-CH ₃	C(0)OEt
4-n-Hex	4-Et	H
4-n-Hex	4-n-Pr	H
4-n-Hex	4-c-Pr	H
4-n-Hex	4-i-Pr	H
4-n-Hex	4-n-Bu	H
4-n-Hex	4-c-Bu	H
4-n-Hex	4-i-Bu	H
4-n-Hex	4-t-Bu	H
4-n-Hex	4-t-Bu	CH ₃
4-n-Hex	4-t-Bu	CH ₂ Ph
4-n-Hex	4-t-Bu	C(0)Ph
4-n-Hex	4-t-Bu	C(0)OEt
4-n-Hex	4-n-Pen	H
4-n-Hex	4-c-Pen	H
4-n-Hex	4-n-Hex	H
4-n-Hex	4-n-Hex	CH ₃
4-n-Hex	4-n-Hex	CH ₂ Ph
4-n-Hex	4-n-Hex	C(0)Ph
4-n-Hex	4-n-Hex	C(0)OEt
4-n-Hex	4-c-Hex	H
4-n-Hex	4-n-C ₇ H ₁₅	H
4-n-Hex	4-n-C ₈ H ₁₇	H
4-n-Hex	4-n-C ₉ H ₁₉	H

[0146] 第9表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³
4-n-Hex	4-n-C ₁₀ H ₂₁	H
4-n-Hex	2, 4-(CH ₃)	H
4-n-Hex	3, 4-(CH ₃) ₂	H
4-n-Hex	4-CF ₃	H
4-n-Hex	4-OH	H
4-n-Hex	2-OCH ₃	H
4-n-Hex	3-OCH ₃	H
4-n-Hex	4-OCH ₃	H
4-n-Hex	4-O-n-Hex	H
4-n-Hex	4-O-c-Hex	H
4-n-Hex	2, 4-(OCH ₃) ₂	H
4-n-Hex	3, 4-(OCH ₃) ₂	H
4-n-Hex	4-OCH ₂ OCH ₃	H
4-n-Hex	4-OC ₂ H ₄ OEt	H
4-n-Hex	4-OCF ₃	H
4-n-Hex	4-OPh	H
4-n-Hex	4-OCH ₂ Ph	H
4-n-Hex	4-C(CH ₃)=NCH ₃	H
4-n-Hex	4-C(CH ₃)=NPh	H
4-n-Hex	4-C(Ph)=NCH ₃	H
4-n-Hex	4-C(Ph)=NPh	H
4-n-Hex	4-C(CH ₃)=NOCH ₃	H
4-n-Hex	4-C(CH ₃)=NOPh	H
4-n-Hex	4-C(Ph)=NOCH ₃	H

4-n-Hex	4-C(Ph)=NPh	H
4-n-Hex	4-C(O)CH ₃	H
4-n-Hex	4-C(O)CF ₃	H
4-n-Hex	4-C(O)Ph	H
4-n-Hex	4-C(O)OCH ₃	H
4-n-Hex	2-C(O)OEt	H
4-n-Hex	3-C(O)OEt	H
4-n-Hex	4-C(O)OEt	H
4-n-Hex	4-C(O)OPh	H
4-n-Hex	4-C(O)OCH ₂ Ph	H
4-n-Hex	4-C(O)OCH(CH ₃)Ph	H
4-n-Hex	4-C(O)OC ₂ H ₄ Ph	H
4-n-Hex	4-SCH ₃	H
4-n-Hex	4-S(O)CH ₃	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ CH ₃	H
4-n-Hex	4-SPh	H
4-n-Hex	4-S(O)Ph	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ Ph	H
4-n-Hex	4-OS(O) ₂ CH ₃	H
4-n-Hex	4-OS(O) ₂ Ph	H
4-n-Hex	4-N(CH ₃) ₂	H

[0147] 第9表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³
4-n-Hex	4-N(CH ₂ Ph) ₂	H
4-n-Hex	4-N(CH ₃)(CH ₂ Ph)	H
4-n-Hex	4-NHCH ₃	H

4-n-Hex	4-NH(CH ₂ Ph)	H
4-n-Hex	4-C(O)N(CH ₃) ₂	H
4-n-Hex	4-C(O)N(CH ₂ Ph) ₂	H
4-n-Hex	4-C(O)N(CH ₃)(CH ₂ Ph)	H
4-n-Hex	4-C(O)NHCH ₃	H
4-n-Hex	4-C(O)NH(CH ₂ Ph)	H
4-n-Hex	4-C(O)NH{CH(CH ₃)Ph}	H
4-n-Hex	4-C(O)NH(C ₂ H ₄ Ph)	H
4-n-Hex	4-C(S)NH ₂	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ N(CH ₃) ₂	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ N(CH ₂ Ph) ₂	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ N(CH ₃)(CH ₂ Ph)	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ NHCH ₃	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ NHPh	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ NH(CH ₂ Ph)	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ NH{CH(CH ₃)Ph}	H
4-n-Hex	4-S(O) ₂ NH(C ₂ H ₄ Ph)	H
4-n-Hex	4-Ph	H
4-n-Hex	4-Ph	CH ₃
4-n-Hex	4-Ph	CH ₂ Ph
4-n-Hex	4-Ph	C(O)Ph
4-n-Hex	4-Ph	C(O)OEt
4-c-Hex	H	H
4-c-Hex	4-Cl	H
4-c-Hex	4-Br	H
4-c-Hex	4-CH ₃	H
4-c-Hex	4-t-Bu	H
4-c-Hex	4-t-Bu	CH ₃

4-c-Hex	4-n-Hex	H
4-c-Hex	4-n-Hex	CH ₃
4-c-Hex	4-Ph	H
4-c-Hex	4-Ph	CH ₃
3,4-(CH ₃) ₂	H	H
3,4-(CH ₃) ₂	4-Cl	H
3,4-(CH ₃) ₂	4-Br	H
3,4-(CH ₃) ₂	4-CH ₃	H
3,4-(CH ₃) ₂	4-t-Bu	H
3,4-(CH ₃) ₂	4-n-Hex	H
3,4-(CH ₃) ₂	4-Ph	H
2,4-(t-Bu) ₂	H	H
2,4-(t-Bu) ₂	4-Cl	H
2,4-(t-Bu) ₂	4-Br	H

[0148] 第9表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³
2,4-(t-Bu) ₂	4-CH ₃	H
2,4-(t-Bu) ₂	4-t-Bu	H
2,4-(t-Bu) ₂	4-n-Hex	H
2,4-(t-Bu) ₂	4-Ph	H
4-CF ₃	H	H
4-CF ₃	4-Cl	H
4-CF ₃	4-Br	H
4-CF ₃	4-CH ₃	H
4-CF ₃	4-t-Bu	H
4-CF ₃	4-n-Hex	H

4-CF ₃	4-Ph	H
4-OH	H	H
4-OH	4-Cl	H
4-OH	4-Br	H
4-OH	4-CH ₃	H
4-OH	4-t-Bu	H
4-OH	4-n-Hex	H
4-OH	4-Ph	H
4-OCH ₃	H	H
4-OCH ₃	4-Cl	H
4-OCH ₃	4-Br	H
4-OCH ₃	4-CH ₃	H
4-OCH ₃	4-t-Bu	H
4-OCH ₃	4-n-Hex	H
4-OCH ₃	4-Ph	H
4-O-i-Pr	H	H
4-O-i-Pr	4-Cl	H
4-O-i-Pr	4-Br	H
4-O-i-Pr	4-CH ₃	H
4-O-i-Pr	4-t-Bu	H
4-O-i-Pr	4-n-Hex	H
4-O-i-Pr	4-Ph	H
4-O-n-Hex	H	H
4-O-n-Hex	4-Cl	H
4-O-n-Hex	4-Br	H
4-O-n-Hex	4-CH ₃	H
4-O-n-Hex	4-t-Bu	H
4-O-n-Hex	4-n-Hex	H

4-0-n-Hex	4-Ph	H
3,4-(OCH ₃) ₂	H	H
3,4-(OCH ₃) ₂	4-Cl	H
3,4-(OCH ₃) ₂	4-Br	H
3,4-(OCH ₃) ₂	4-CH ₃	H
3,4-(OCH ₃) ₂	4-t-Bu	H
3,4-(OCH ₃) ₂	4-n-Hex	H

[0149] 第9表 (続き)

R ²¹	R ⁸¹	R ³
3,4-(OCH ₃) ₂	4-Ph	H
4-OC ₂ H ₄ OEt	H	H
4-OC ₂ H ₄ OEt	4-Cl	H
4-OC ₂ H ₄ OEt	4-Br	H
4-OC ₂ H ₄ OEt	4-CH ₃	H
4-OC ₂ H ₄ OEt	4-t-Bu	H
4-OC ₂ H ₄ OEt	4-n-Hex	H
4-OC ₂ H ₄ OEt	4-Ph	H
4-OPh	H	H
4-OPh	4-Cl	H
4-OPh	4-Br	H
4-OPh	4-CH ₃	H
4-OPh	4-t-Bu	H
4-OPh	4-n-Hex	H
4-OPh	4-Ph	H
4-OCH ₂ Ph	H	H
4-OCH ₂ Ph	4-Cl	H

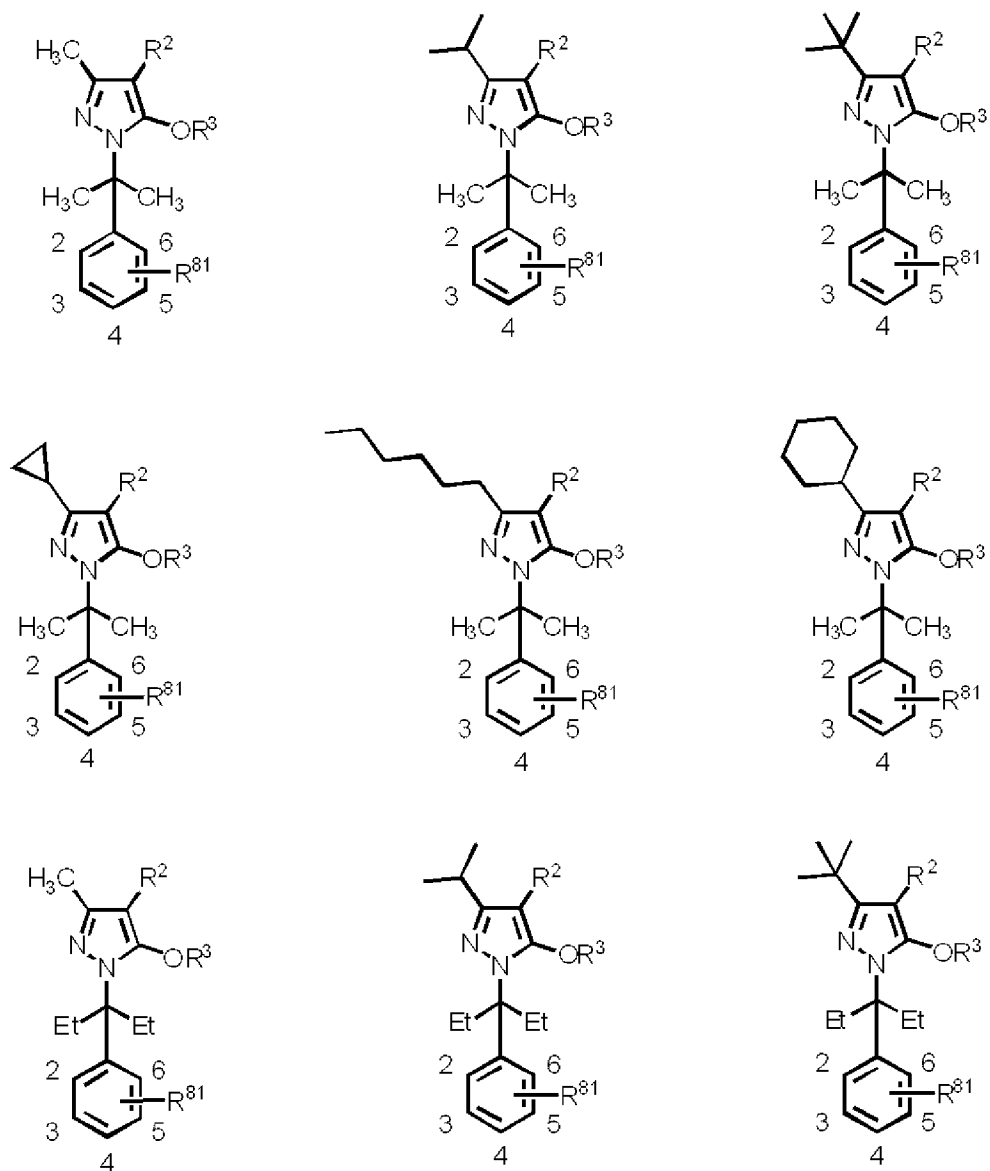
4-OCH ₂ Ph	4-Br	H
4-OCH ₂ Ph	4-CH ₃	H
4-OCH ₂ Ph	4-t-Bu	H
4-OCH ₂ Ph	4-n-Hex	H
4-OCH ₂ Ph	4-Ph	H
4-Ph	H	H
4-Ph	4-Cl	H
4-Ph	4-Br	H
4-Ph	4-CH ₃	H
4-Ph	4-t-Bu	H
4-Ph	4-t-Bu	CH ₃
4-Ph	4-n-Hex	H
4-Ph	4-n-Hex	CH ₃
4-Ph	4-Ph	H
4-Ph	4-Ph	CH ₃

第 10 表

表中、置換基R⁸¹の置換位置を表す番号は、それぞれ下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものであり、一の表記は、無置換を表す。

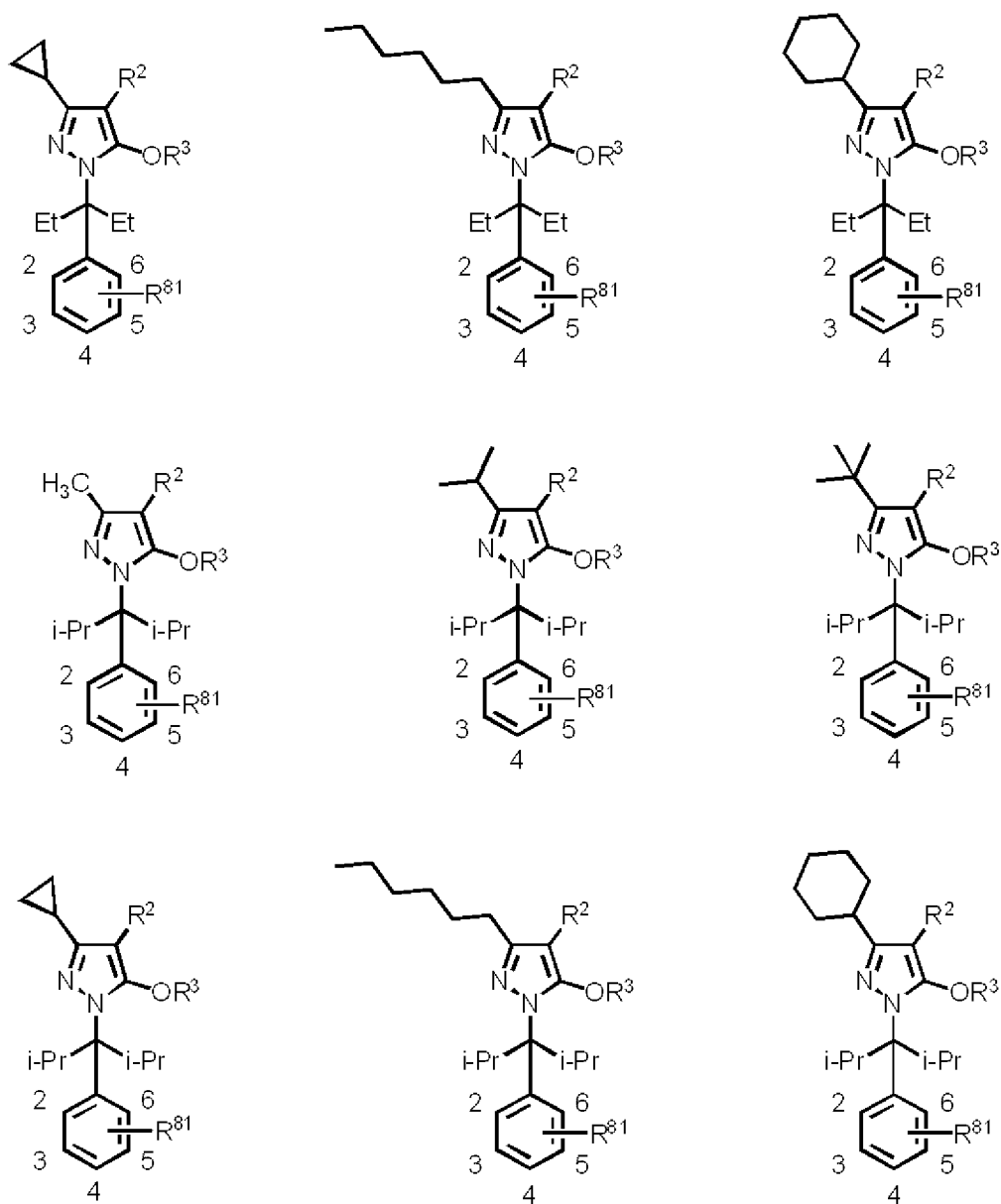
[0150]

[化41]



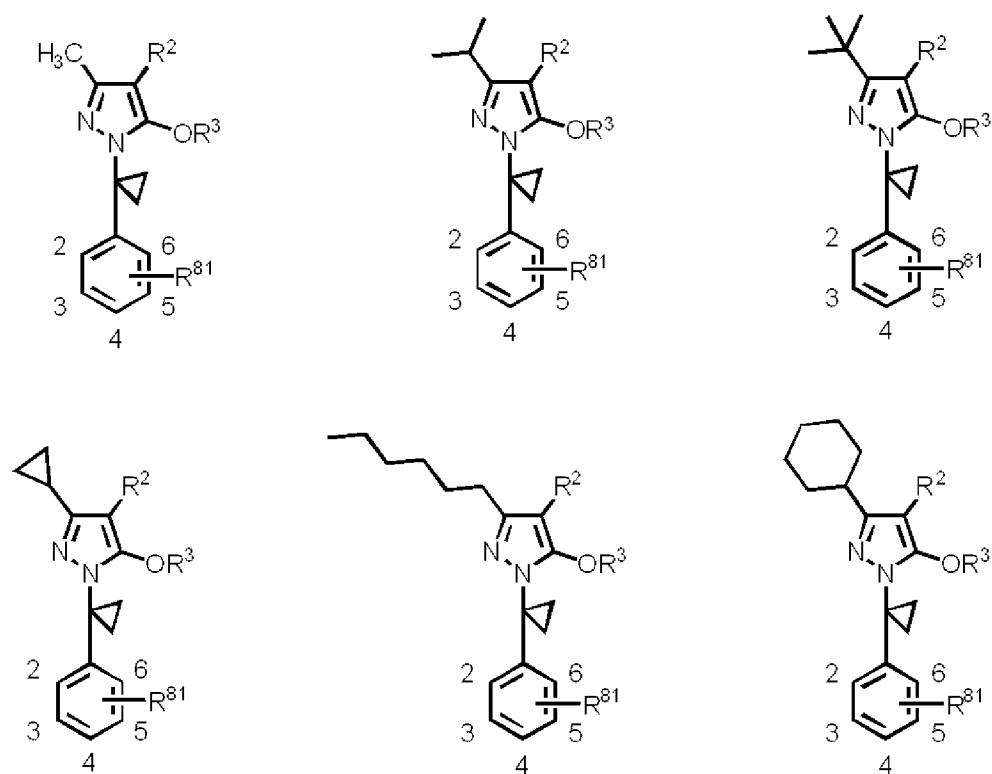
[0151]

[化42]



[0152]

[化43]



[0153]

R ²	(Z) _m	R ⁸¹	R ³
H	—	H	H
H	—	4-CH ₃	H
F	—	H	H
CH ₃	—	H	H
Et	—	H	H
n-Pr	—	H	H
c-Pr	—	H	H
i-Pr	—	H	H
n-Bu	—	H	H
c-Bu	—	H	H
i-Bu	—	H	H
t-Bu	—	H	H

n-Pen	-	H	H
c-Pen	-	H	H
n-Hex	-	H	H
c-Hex	-	H	H
n-C ₇ H ₁₅	-	H	H
n-C ₈ H ₁₇	-	H	H
n-C ₉ H ₁₉	-	H	H
n-C ₁₀ H ₂₂	-	H	H
CF ₃	-	H	H
C(Ph)=NCH ₃	-	H	H
C(CH ₃)=NPh	-	H	H
C(Ph)=NOCH ₃	-	H	H
C(O)CH ₃	-	H	H
C(O)Et	-	H	H
C(O)CF ₃	-	H	H
C(O)Ph	-	H	H
C(O)Ph	-	4-Cl	H
C(O)Ph	-	4-CH ₃	H
C(O)Ph	-	4-CH ₃	CH ₃
C(O)Ph	-	4-CH ₃	CH ₂ Ph
C(O)Ph	-	4-CH ₃	C(O)Ph
C(O)Ph	-	4-CH ₃	C(O)OEt
C(O)Ph	-	4-t-Bu	H
C(O)Ph	-	4-n-hex	H
C(O)Ph	-	4-OCH ₃	H
C(O)Ph	-	4-Ph	H
C(O)CH ₂ Ph	-	H	H
C(O)CH(CH ₃)Ph	-	H	H

C(O)C ₂ H ₄ Ph	—	H	H
C(O)OCH ₃	—	H	H
C(O)OEt	—	H	H
C(O)OEt	—	4-Cl	H
C(O)OEt	—	4-CH ₃	H
C(O)OEt	—	4-CH ₃	CH ₃

[0154] 第 1 O 表 (続き)

R ²	(Z) _m	R ⁸¹	R ³
C(O)OEt	—	4-CH ₃	CH ₂ Ph
C(O)OEt	—	4-CH ₃	C(O)Ph
C(O)OEt	—	4-CH ₃	C(O)OEt
C(O)OEt	—	4-t-Bu	H
C(O)OEt	—	4-n-hex	H
C(O)OEt	—	4-OCH ₃	H
C(O)OEt	—	4-Ph	H
C(O)OPh	—	H	H
C(O)OCH ₂ Ph	—	H	H
C(O)OCH(CH ₃)Ph	—	H	H
C(O)OC ₂ H ₄ Ph	—	H	H
C(O)N(CH ₃) ₂	—	H	H
C(O)NHCH ₃	—	H	H
C(O)NH(CH ₂ Ph)	—	H	H
CH ₂ Ph	—	H	H
CH ₂ (4-Cl-Ph)	—	H	H
A001	H	H	H
A001	3-n-Bu	H	H

A002	H	H	H
A002	2-Cl	H	H
A003	H	H	H
A004	H	H	H
A005	H	H	H
A005	H	4-Cl	H
A005	H	4-CH ₃	H
A005	H	4-CH ₃	CH ₃
A005	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph
A005	H	4-CH ₃	C(O)Ph
A005	H	4-CH ₃	C(O)OEt
A005	H	4-t-Bu	H
A005	H	4-n-hex	H
A005	H	4-OCH ₃	H
A005	H	4-Ph	H
A005	2,5-(CH ₃) ₂	H	H
A005	2,5-Cl ₂	H	H
A005	2-Br	H	H
A006	H	H	H
A006	H	4-Cl	H
A006	H	4-CH ₃	H
A006	H	4-CH ₃	CH ₃
A006	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph
A006	H	4-CH ₃	C(O)Ph
A006	H	4-CH ₃	C(O)OEt
A006	H	4-t-Bu	H
A006	H	4-n-hex	H

R ²	(Z) _m	R ⁸¹	R ³
A006	H	4-OCH ₃	H
A006	H	4-Ph	H
A006	3-CH ₃	H	H
A006	5-CH ₃	H	H
A006	3-Cl	H	H
A006	5-Et	H	H
A006	5-Cl	H	H
A006	5-Br	H	H
A006	3-Br	H	H
A006	4-Br	H	H
A006	5-NO ₂	H	H
A007	H	H	H
A007	5-CH ₃	H	H
A007	3-CH ₃	H	H
A007	5-Br	H	H
A007	5-NO ₂	H	H
A007	5-Ph	H	H
A008	5-CH ₃	H	H
A009	5-CH ₃	H	H
A010	3, 5-(CH ₃) ₂	H	H
A010	3, 5-Cl ₂	H	H
A011	3, 5-(CH ₃) ₂	H	H
A011	3, 5-Cl ₂	H	H
A012	3-CH ₃	H	H
A012	3-CH ₃	H	H

A012	3-Cl	H	H
A013	3-CH ₃	H	H
A013	3-CH ₃	H	H
A013	3-Cl	H	H
A014	H	H	H
A014	H	4-Cl	H
A014	H	4-CH ₃	H
A014	H	4-CH ₃	CH ₃
A014	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph
A014	H	4-CH ₃	C(O)Ph
A014	H	4-CH ₃	C(O)OEt
A014	H	4-t-Bu	H
A014	H	4-n-hex	H
A014	H	4-OCH ₃	H
A014	H	4-Ph	H
A015	H	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	H	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-Cl	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-CH ₃	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-CH ₃	CH ₃

[0156] 第10表 (続き)

R ²	(Z) _m	R ⁸¹	R ³
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-CH ₃	CH ₂ Ph
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-CH ₃	C(O)Ph
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-CH ₃	C(O)OEt
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-t-Bu	H

A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-n-hex	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-OCH ₃	H
A016	2,4-(CH ₃) ₂	4-Ph	H
A017	2,4-(CH ₃) ₂	H	H
A018	H	H	H
A018	3-CH ₃	H	H
A019	3-Ph, 5-CH ₃	H	H
A019	3,5-(CH ₃) ₂	H	H
A020	5-CH ₃	H	H
A021	4-CH ₃	H	H
A022	H	H	H
A023	2,4-(CH ₃) ₂	H	H
A024	2-(4-pyridil)	H	H
A025	H	H	H
A026	H	H	H
A026	4-CH ₃	H	H
A027	H	H	H
A027	4-CH ₃	H	H
A028	H	H	H
A029	H	H	H
A030	H	H	H
A031	H	H	H
A032	H	H	H
A033	H	H	H
A034	H	H	H
A034	3,6-Cl ₂	H	H
A035	H	H	H
A036	H	H	H

A036	H	4-Cl	H
A036	H	4-CH ₃	H
A036	H	4-CH ₃	CH ₃
A036	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph
A036	H	4-CH ₃	C(O)Ph
A036	H	4-CH ₃	C(O)OEt
A036	H	4-t-Bu	H
A036	H	4-n-hex	H
A036	H	4-OCH ₃	H
A036	H	4-Ph	H
A037	H	H	H
A037	H	4-Cl	H
A037	H	4-CH ₃	H

[0157] 第10表 (続き)

R ²	(Z) _m	R ⁸¹	R ³
A037	H	4-CH ₃	CH ₃
A037	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph
A037	H	4-CH ₃	C(O)Ph
A037	H	4-CH ₃	C(O)OEt
A037	H	4-t-Bu	H
A037	H	4-n-hex	H
A037	H	4-OCH ₃	H
A037	H	4-Ph	H
A037	6-OCH ₃	H	H
A037	6-Br	H	H
A038	H	H	H

A038	H	4-Cl	H
A038	H	4-CH ₃	H
A038	H	4-CH ₃	CH ₃
A038	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph
A038	H	4-CH ₃	C(=O)Ph
A038	H	4-CH ₃	C(=O)OEt
A038	H	4-t-Bu	H
A038	H	4-n-hex	H
A038	H	4-OCH ₃	H
A038	H	4-Ph	H
A038	2-OCH ₃	H	H
A038	4-OCH ₃	H	H
A038	4-F	H	H
A039	H	H	H
A039	3-CH ₃	H	H
A039	7-OCH ₃	H	H
A040	H	H	H
A041	H	H	H
A041	H	4-Cl	H
A041	H	4-CH ₃	H
A041	H	4-CH ₃	CH ₃
A041	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph
A041	H	4-CH ₃	C(=O)Ph
A041	H	4-CH ₃	C(=O)OEt
A041	H	4-t-Bu	H
A041	H	4-n-hex	H
A041	H	4-OCH ₃	H
A041	H	4-Ph	H

A041	6-NO ₂	H	H
A041	6-Br	H	H
A042	H	H	H
A042	H	4-Cl	H
A042	H	4-CH ₃	H
A042	H	4-CH ₃	CH ₃

[0158] 第 1 O 表 (続き)

R ²	(Z) _m	R ⁸¹	R ³
A042	H	4-CH ₃	CH ₂ Ph
A042	H	4-CH ₃	C(O)Ph
A042	H	4-CH ₃	C(O)OEt
A042	H	4-t-Bu	H
A042	H	4-n-hex	H
A042	H	4-OCH ₃	H
A042	H	4-Ph	H
A042	5-Br	H	H
A043	H	H	H
A044	H	H	H
A051	-	H	H
A052	-	H	H
A053	-	H	H
A054	-	H	H
A055	-	H	H
A056	-	H	H
A057	-	H	H
A058	-	H	H

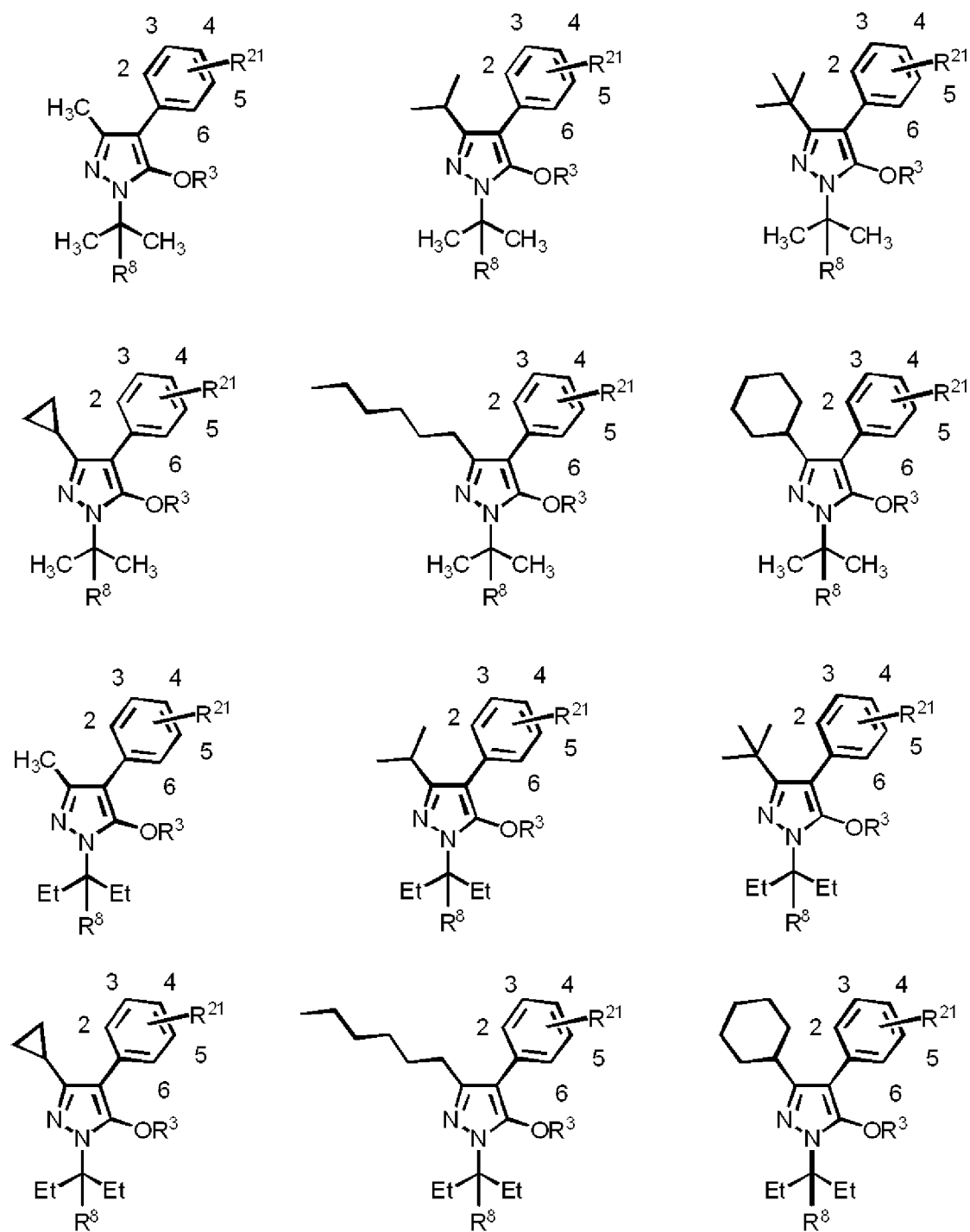
A059	-	H	H
A060	-	H	H
A061	-	H	H
A062	-	H	H
A063	-	H	H
A064	-	H	H
A065	-	H	H
A066	-	H	H
A067	-	H	H
A068	-	H	H
A101	-	H	H
A102	-	H	H
A103	-	H	H
A104	-	H	H
A105	-	H	H
A106	-	H	H
A107	-	H	H

第 1 1 表

表中、置換基 R^{21} の置換位置を表す番号は、それぞれ下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものであり、-の表記は、無置換を表す。

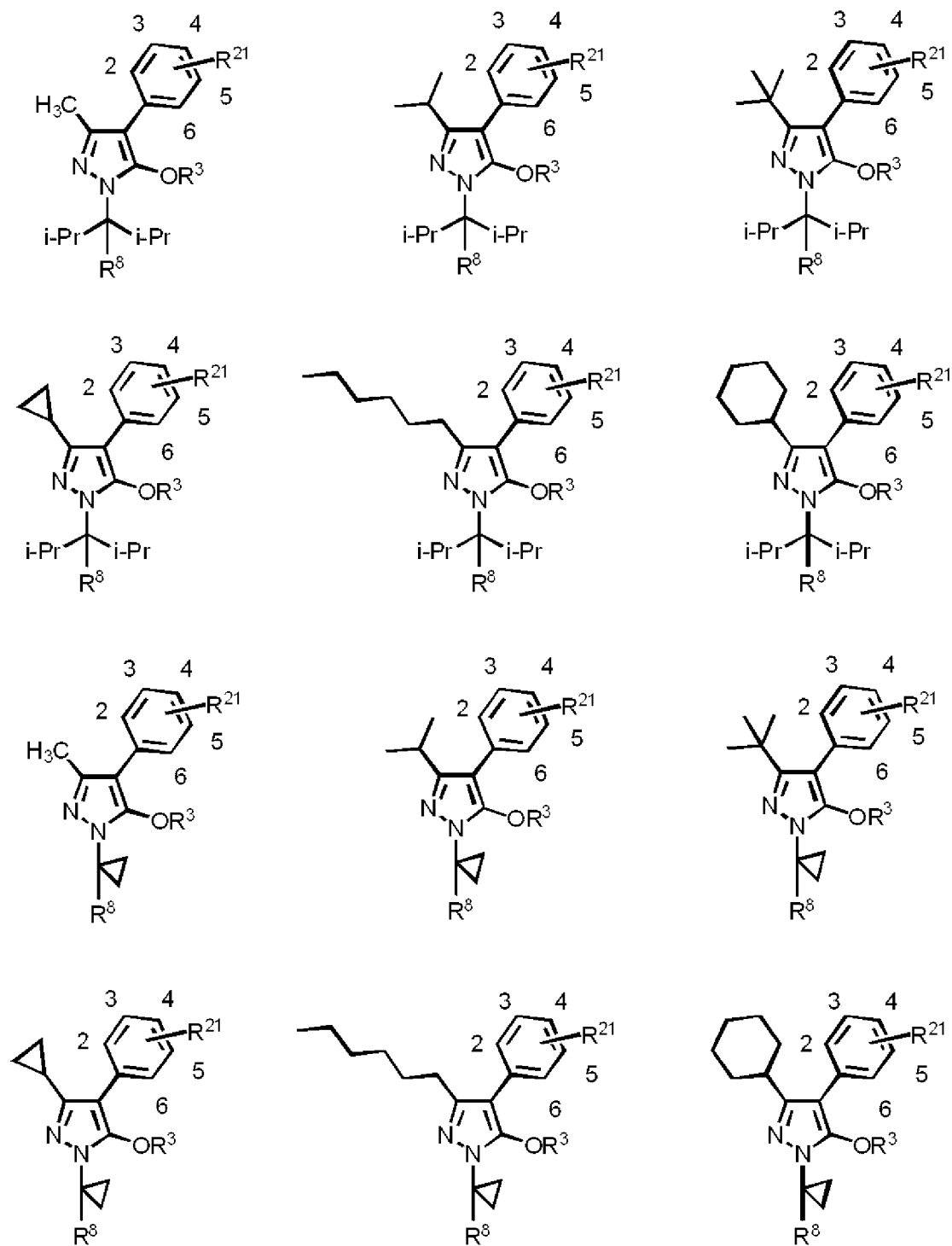
[0159]

[化44]



[0160]

[化45]



[0161]

R²¹R⁸(Z)_mR³

H

c-Pr

-

H

4-Cl	c-Pr	-	H
4-CH ₃	c-Pr	-	H
4-CH ₃	c-Pr	-	CH ₃
4-CH ₃	c-Pr	-	CH ₂ Ph
4-CH ₃	c-Pr	-	C(O)Ph
4-CH ₃	c-Pr	-	C(O)OEt
4-t-Bu	c-Pr	-	H
4-n-hex	c-Pr	-	H
4-n-hex	c-Pr	-	CH ₃
4-n-hex	c-Pr	-	CH ₂ Ph
4-n-hex	c-Pr	-	C(O)Ph
4-n-hex	c-Pr	-	C(O)OEt
4-OCH ₃	c-Pr	-	H
4-Ph	c-Pr	-	H
H	c-Bu	-	H
H	c-Pen	-	H
H	c-Hex	-	H
4-Cl	c-Hex	-	H
4-CH ₃	c-Hex	-	H
4-CH ₃	c-Hex	-	CH ₃
4-CH ₃	c-Hex	-	CH ₂ Ph
4-CH ₃	c-Hex	-	C(O)Ph
4-CH ₃	c-Hex	-	C(O)OEt
4-t-Bu	c-Hex	-	H
4-n-hex	c-Hex	-	H
4-n-hex	c-Hex	-	CH ₃
4-n-hex	c-Hex	-	CH ₂ Ph
4-n-hex	c-Hex	-	C(O)Ph

4-n-hex	c-Hex	-	C(O)OEt
4-OCH ₃	c-Hex	-	H
4-Ph	c-Hex	-	H
H	c-C ₇ H ₁₅	-	H
H	c-C ₈ H ₁₇	-	H
H	bicyclo[2.2.1]heptan-2-yl	-	H
H	1-adamantyl	-	H
H	2-adamantyl	-	H
H	A001	H	H
H	A001	3-n-Bu	H
H	A002	H	H
H	A002	2-Cl	H
H	A003	H	H
H	A004	H	H
H	A005	H	H
4-Cl	A005	H	H
4-CH ₃	A005	H	H

[0162] 第 1 1 表 (続き)

R ²¹	R ⁸	(Z) _m	R ³
4-CH ₃	A005	H	CH ₃
4-CH ₃	A005	H	CH ₂ Ph
4-CH ₃	A005	H	C(O)Ph
4-CH ₃	A005	H	C(O)OEt
4-t-Bu	A005	H	H
4-n-hex	A005	H	H
4-n-hex	A005	H	CH ₃

4-n-hex	A005	H	CH ₂ Ph
4-n-hex	A005	H	C(O)Ph
4-n-hex	A005	H	C(O)OEt
4-OCH ₃	A005	H	H
4-Ph	A005	H	H
H	A005	2,5-(CH ₃) ₂	H
H	A005	2,5-Cl ₂	H
H	A005	2-Br	H
H	A006	H	H
4-Cl	A006	H	H
4-CH ₃	A006	H	H
4-CH ₃	A006	H	CH ₃
4-CH ₃	A006	H	CH ₂ Ph
4-CH ₃	A006	H	C(O)Ph
4-CH ₃	A006	H	C(O)OEt
4-t-Bu	A006	H	H
4-n-hex	A006	H	H
4-n-hex	A006	H	CH ₃
4-n-hex	A006	H	CH ₂ Ph
4-n-hex	A006	H	C(O)Ph
4-n-hex	A006	H	C(O)OEt
4-OCH ₃	A006	H	H
4-Ph	A006	H	H
H	A006	3-CH ₃	H
H	A006	5-CH ₃	H
H	A006	3-Cl	H
H	A006	5-Et	H
H	A006	5-Cl	H

H	A006	5-Br	H
H	A006	3-Br	H
H	A006	4-Br	H
H	A006	5-NO ₂	H
H	A007	H	H
H	A007	5-CH ₃	H
H	A007	3-CH ₃	H
H	A007	5-Br	H
H	A007	5-NO ₂	H
H	A007	5-Ph	H

[0163] 第 1 1 表 (続き)

R ²¹	R ⁸	(Z) _m	R ³
H	A008	5-CH ₃	H
H	A009	5-CH ₃	H
H	A010	3, 5-(CH ₃) ₂	H
H	A010	3, 5-Cl ₂	H
H	A011	3, 5-(CH ₃) ₂	H
H	A011	3, 5-Cl ₂	H
H	A012	3-CH ₃	H
H	A012	3-Me	H
H	A012	3-Cl	H
H	A013	3-CH ₃	H
H	A013	3-Me	H
H	A013	3-Cl	H
H	A014	H	H
4-Cl	A014	H	H

4-CH ₃	A014	H	H
4-CH ₃	A014	H	CH ₃
4-CH ₃	A014	H	CH ₂ Ph
4-CH ₃	A014	H	C(O)Ph
4-CH ₃	A014	H	C(O)OEt
4-t-Bu	A014	H	H
4-n-hex	A014	H	H
4-OCH ₃	A014	H	H
4-Ph	A014	H	H
H	A015	H	H
H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H
4-Cl	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H
4-CH ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H
4-CH ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	CH ₃
4-CH ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	CH ₂ Ph
4-CH ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	C(O)Ph
4-CH ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	C(O)OEt
4-t-Bu	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H
4-n-hex	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H
4-OCH ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H
4-Ph	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H
H	A017	2, 4-(CH ₃) ₂	H
H	A018	H	H
H	A018	3-CH ₃	H
H	A019	3-Ph, 5-CH ₃	H
H	A019	3, 5-(CH ₃) ₂	H
H	A020	5-CH ₃	H
H	A021	4-CH ₃	H

H	A022	H	H
H	A023	2,4-(CH ₃) ₂	H
H	A024	2-(4-pyridil)	H

[0164] 第 1 1 表 (続き)

R ²¹	R ⁸	(Z) _m	R ³
H	A025	H	H
H	A026	H	H
H	A026	4-CH ₃	H
H	A027	H	H
H	A027	4-CH ₃	H
H	A028	H	H
H	A029	H	H
H	A030	H	H
H	A031	H	H
H	A032	H	H
H	A033	H	H
H	A034	H	H
H	A034	3,6-Cl ₂	H
H	A035	H	H
H	A036	H	H
H	A037	H	H
4-Cl	A037	H	H
4-CH ₃	A037	H	H
4-CH ₃	A037	H	CH ₃
4-CH ₃	A037	H	CH ₂ Ph
4-CH ₃	A037	H	C(O)Ph

4-CH ₃	A037	H	C(O)OEt
4-t-Bu	A037	H	H
4-n-hex	A037	H	H
4-n-hex	A037	H	CH ₃
4-n-hex	A037	H	CH ₂ Ph
4-n-hex	A037	H	C(O)Ph
4-n-hex	A037	H	C(O)OEt
4-OCH ₃	A037	H	H
4-Ph	A037	H	H
H	A037	6-OCH ₃	H
H	A037	6-Br	H
H	A038	H	H
4-Cl	A038	H	H
4-CH ₃	A038	H	H
4-CH ₃	A038	H	CH ₃
4-CH ₃	A038	H	CH ₂ Ph
4-CH ₃	A038	H	C(O)Ph
4-CH ₃	A038	H	C(O)OEt
4-t-Bu	A038	H	H
4-n-hex	A038	H	H
4-n-hex	A038	H	CH ₃
4-n-hex	A038	H	CH ₂ Ph
4-n-hex	A038	H	C(O)Ph
4-n-hex	A038	H	C(O)OEt

[0165] 第 1 1 表 (続き)

R²¹R⁸(Z)_mR³

4-OCH ₃	A038	H	H
4-Ph	A038	H	H
H	A038	2-OCH ₃	H
H	A038	4-OCH ₃	H
H	A038	4-F	H
H	A039	H	H
H	A039	3-CH ₃	H
H	A039	7-OCH ₃	H
H	A040	H	H
H	A041	H	H
4-Cl	A041	H	H
4-CH ₃	A041	H	H
4-CH ₃	A041	H	CH ₃
4-CH ₃	A041	H	CH ₂ Ph
4-CH ₃	A041	H	C(O)Ph
4-CH ₃	A041	H	C(O)OEt
4-t-Bu	A041	H	H
4-n-hex	A041	H	H
4-OCH ₃	A041	H	H
4-Ph	A041	H	H
H	A041	6-NO ₂	H
H	A041	6-Br	H
H	A042	H	H
4-Cl	A042	H	H
4-CH ₃	A042	H	H
4-CH ₃	A042	H	CH ₃
4-CH ₃	A042	H	CH ₂ Ph
4-CH ₃	A042	H	C(O)Ph

4-CH ₃	A042	H	C(0)OEt
4-t-Bu	A042	H	H
4-n-hex	A042	H	H
4-OCH ₃	A042	H	H
4-Ph	A042	H	H
H	A042	5-Br	H
H	A043	H	H
4-Cl	A043	H	H
4-CH ₃	A043	H	H
4-CH ₃	A043	H	CH ₃
4-CH ₃	A043	H	CH ₂ Ph
4-CH ₃	A043	H	C(0)Ph
4-CH ₃	A043	H	C(0)OEt
4-t-Bu	A043	H	H
4-n-hex	A043	H	H
4-OCH ₃	A043	H	H
4-Ph	A043	H	H

[0166] 第 1 1 表 (続き)

R ²¹	R ⁸	(Z) _m	R ³
H	A044	H	H
4-Cl	A044	H	H
4-CH ₃	A044	H	H
4-CH ₃	A044	H	CH ₃
4-CH ₃	A044	H	CH ₂ Ph
4-CH ₃	A044	H	C(0)Ph
4-CH ₃	A044	H	C(0)OEt

4-t-Bu	A044	H	H
4-n-hex	A044	H	H
4-OCH ₃	A044	H	H
4-Ph	A044	H	H
H	A051	—	H
H	A052	—	H
H	A053	—	H
H	A054	—	H
H	A055	—	H
H	A056	—	H
H	A057	—	H
H	A058	—	H
H	A059	—	H
H	A060	—	H
H	A061	—	H
H	A062	—	H
H	A063	—	H
H	A064	—	H
H	A065	—	H
H	A066	—	H
H	A067	—	H
H	A068	—	H
H	A101	—	H
H	A102	—	H
H	A103	—	H
H	A104	—	H
H	A105	—	H
H	A106	—	H

H

A107

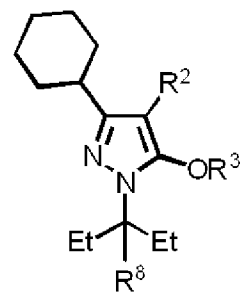
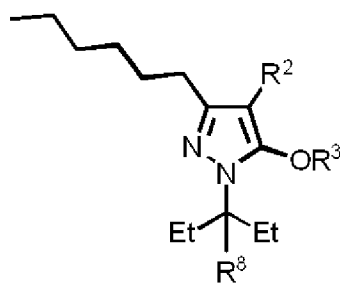
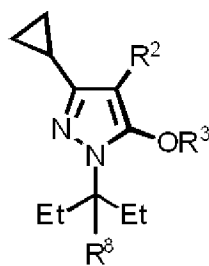
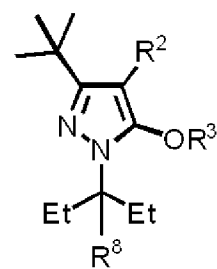
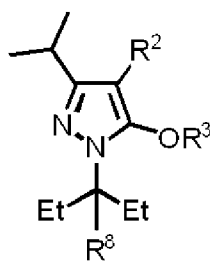
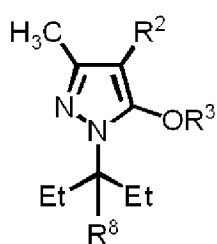
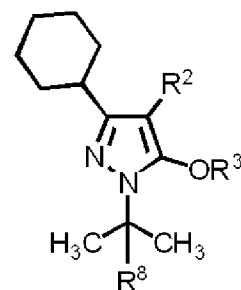
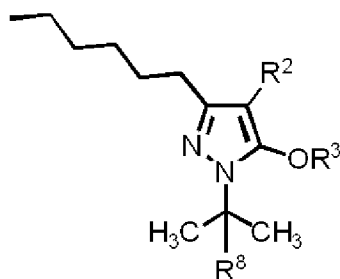
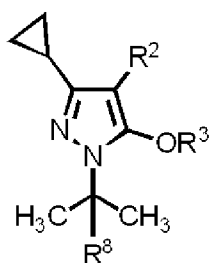
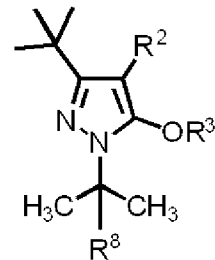
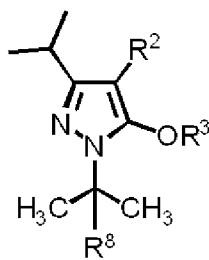
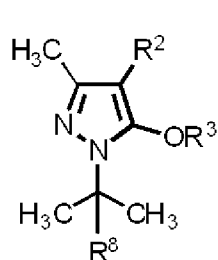
-

H

第12表

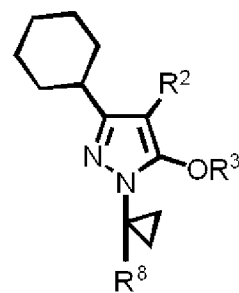
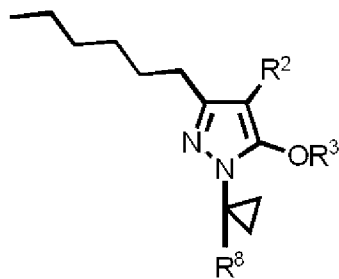
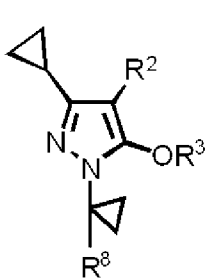
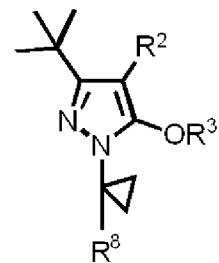
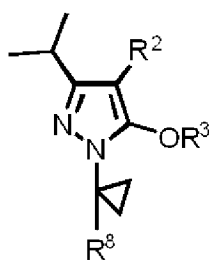
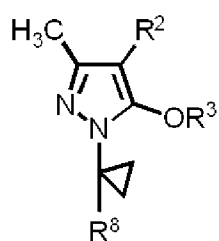
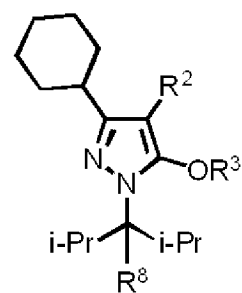
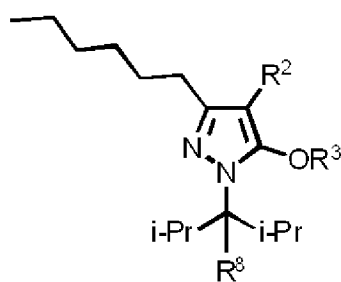
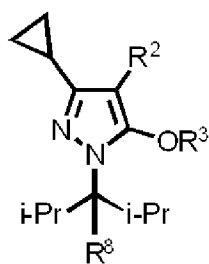
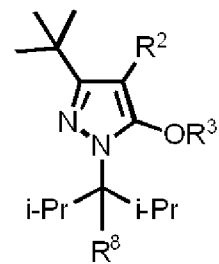
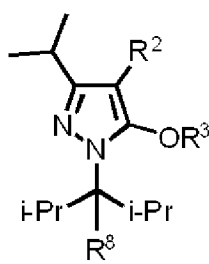
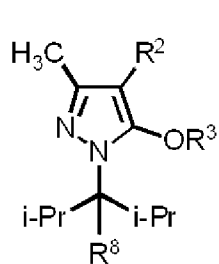
表中、-の表記は、無置換を表す。

[0167] [化46]



[0168]

[化47]



[0169]

R ²	(Z) _m	R ⁸	(Z) _m	R ³
	on ring of R ²		on ring of R ⁸	
H	-	c-Pr	-	H

CH ₃	-	c-Pr	-	H
H	-	c-Bu	-	H
CH ₃	-	c-Bu	-	H
H	-	c-Pen	-	H
CH ₃	-	c-Pen	-	H
H	-	c-Hex	-	H
CH ₃	-	c-Hex	-	H
CH ₃	-	c-Hex	-	CH ₃
CH ₃	-	c-Hex	-	CH ₂ Ph
CH ₃	-	c-Hex	-	C(0)Ph
CH ₃	-	c-Hex	-	C(0)OEt
C(0)CH ₃	-	c-Pr	-	H
C(0)CH ₃	-	c-Hex	-	H
C(0)CH ₃	-	c-Hex	-	CH ₃
C(0)CH ₃	-	c-Hex	-	CH ₂ Ph
C(0)CH ₃	-	c-Hex	-	C(0)Ph
C(0)CH ₃	-	c-Hex	-	C(0)OEt
C(0)Ph	-	c-Pr	-	H
C(0)Ph	-	c-Hex	-	H
C(0)Ph	-	c-Hex	-	CH ₃
C(0)Ph	-	c-Hex	-	CH ₂ Ph
C(0)Ph	-	c-Hex	-	C(0)Ph
C(0)Ph	-	c-Hex	-	C(0)OEt
A005	H	A005	H	H
A005	H	A006	H	H
A005	H	A014	H	H
A005	H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H
A005	H	A037	H	H

A005	H	A038	H	H
A005	H	A041	H	H
A005	H	A042	H	H
A005	H	A043	H	H
A005	H	A044	H	H
A006	H	A005	H	H
A006	H	A006	H	H
A006	H	A006	H	CH ₃
A006	H	A006	H	CH ₂ Ph
A006	H	A006	H	C(O)Ph
A006	H	A014	H	H
A006	H	A016	2,4-(CH ₃) ₂	CH
A006	H	A037	H	H
A006	H	A037	H	CH ₃
A006	H	A037	H	CH ₂ Ph
A006	H	A037	H	C(O)Ph

[0170] 第12表 (続き)

R ²	(Z) _m on ring of R ²	R ⁸	(Z) _m on ring of R ⁸	R ³
A006	H	A038	H	H
A006	H	A038	H	CH ₃
A006	H	A038	H	CH ₂ Ph
A006	H	A038	H	C(O)Ph
A006	H	A041	H	H
A006	H	A041	H	CH ₃
A006	H	A041	H	CH ₂ Ph

A006	H	A041	H	C(O)Ph
A006	H	A042	H	H
A006	H	A042	H	CH ₃
A006	H	A042	H	CH ₂ Ph
A006	H	A042	H	C(O)Ph
A006	H	A043	H	H
A006	H	A044	H	H
A014	H	A005	H	H
A014	H	A006	H	H
A014	H	A014	H	H
A014	H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H
A014	H	A037	H	H
A014	H	A038	H	H
A014	H	A041	H	H
A014	H	A042	H	H
A014	H	A043	H	H
A014	H	A044	H	H
A016	2, 4-(CH ₃) ₂	A005	H	H
A016	2, 4-(CH ₃) ₂	A006	H	H
A016	2, 4-(CH ₃) ₂	A014	H	H
A016	2, 4-(CH ₃) ₂	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H
A016	2, 4-(CH ₃) ₂	A037	H	H
A016	2, 4-(CH ₃) ₂	A038	H	H
A016	2, 4-(CH ₃) ₂	A041	H	H
A016	2, 4-(CH ₃) ₂	A042	H	H
A016	2, 4-(CH ₃) ₂	A043	H	H
A016	2, 4-(CH ₃) ₂	A044	H	H
A036	H	A005	H	H

A036	H	A006	H	H
A036	H	A014	H	H
A036	H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H
A036	H	A037	H	H
A036	H	A038	H	H
A036	H	A041	H	H
A036	H	A042	H	H
A036	H	A043	H	H
A036	H	A044	H	H

[0171] 第 1 2 表 (続き)

R ²	(Z) _m on ring of R ²	R ⁸	(Z) _m on ring of R ⁸	R ³
A037	H	A005	H	H
A037	H	A006	H	H
A037	H	A006	H	CH ₃
A037	H	A006	H	CH ₂ Ph
A037	H	A006	H	C(O)Ph
A037	H	A014	H	H
A037	H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H
A037	H	A037	H	H
A037	H	A037	H	CH ₃
A037	H	A037	H	CH ₂ Ph
A037	H	A037	H	C(O)Ph
A037	H	A038	H	H
A037	H	A038	H	CH ₃
A037	H	A038	H	CH ₂ Ph

A037	H	A038	H	C(0)Ph
A037	H	A041	H	H
A037	H	A041	H	CH ₃
A037	H	A041	H	1CH ₂ Ph
A037	H	A041	H	C(0)Ph
A037	H	A042	H	H
A037	H	A042	H	CH ₃
A037	H	A042	H	CH ₂ Ph
A037	H	A042	H	C(0)Ph
A037	H	A043	H	H
A037	H	A044	H	H
A038	H	A005	H	H
A038	H	A006	H	H
A038	H	A006	H	CH ₃
A038	H	A006	H	CH ₂ Ph
A038	H	A006	H	C(0)Ph
A038	H	A014	H	H
A038	H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H
A038	H	A037	H	H
A038	H	A037	H	CH ₃
A038	H	A037	H	CH ₂ Ph
A038	H	A037	H	C(0)Ph
A038	H	A038	H	H
A038	H	A038	H	CH ₃
A038	H	A038	H	CH ₂ Ph
A038	H	A038	H	C(0)Ph
A038	H	A041	H	H
A038	H	A041	H	CH ₃

A038	H	A041	H	CH ₂ Ph
A038	H	A041	H	C(O)Ph

[0172] 第 1 2 表 (続き)

R ²	(Z) _m on ring of R ²	R ⁸	(Z) _m on ring of R ⁸	R ³
A038	H	A042	H	H
A038	H	A042	H	CH ₃
A038	H	A042	H	CH ₂ Ph
A038	H	A042	H	C(O)Ph
A038	H	A043	H	H
A038	H	A044	H	H
A041	H	A005	H	H
A041	H	A006	H	H
A041	H	A006	H	CH ₃
A041	H	A006	H	CH ₂ Ph
A041	H	A006	H	C(O)Ph
A041	H	A014	H	H
A041	H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H
A041	H	A037	H	H
A041	H	A037	H	CH ₃
A041	H	A037	H	CH ₂ Ph
A041	H	A037	H	C(O)Ph
A041	H	A038	H	H
A041	H	A038	H	CH ₃
A041	H	A038	H	CH ₂ Ph
A041	H	A038	H	C(O)Ph

A041	H	A041	H	H
A041	H	A041	H	CH ₃
A041	H	A041	H	CH ₂ Ph
A041	H	A041	H	C(O)Ph
A041	H	A042	H	H
A041	H	A042	H	CH ₃
A041	H	A042	H	CH ₂ Ph
A041	H	A042	H	C(O)Ph
A041	H	A043	H	H
A041	H	A044	H	H
A042	H	A005	H	H
A042	H	A006	H	H
A042	H	A006	H	CH ₃
A042	H	A006	H	CH ₂ Ph
A042	H	A006	H	C(O)Ph
A042	H	A014	H	H
A042	H	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H
A042	H	A037	H	H
A042	H	A037	H	CH ₃
A042	H	A037	H	CH ₂ Ph
A042	H	A037	H	C(O)Ph
A042	H	A038	H	H
A042	H	A038	H	CH ₃

[0173] 第 1 2 表 (続き)

R ²	(Z) _m	R ⁸	(Z) _m	R ³
	on ring of R ²		on ring of R ⁸	

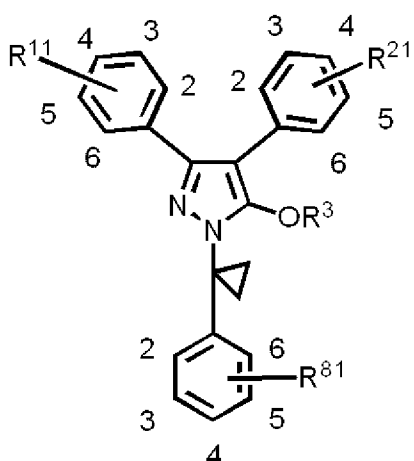
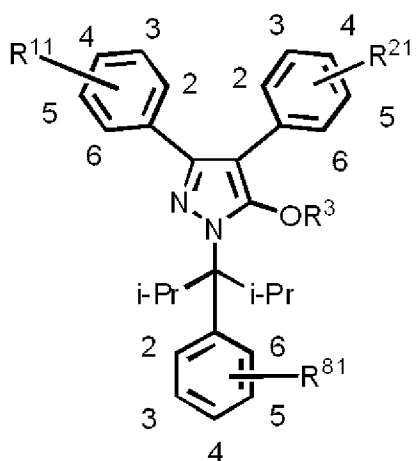
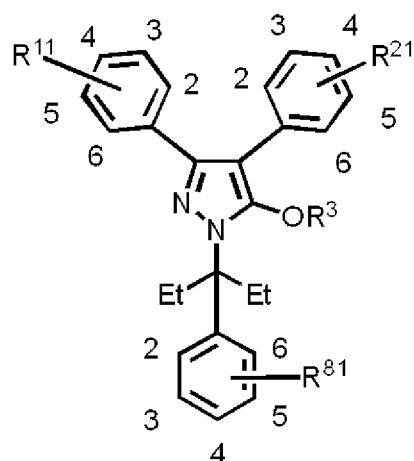
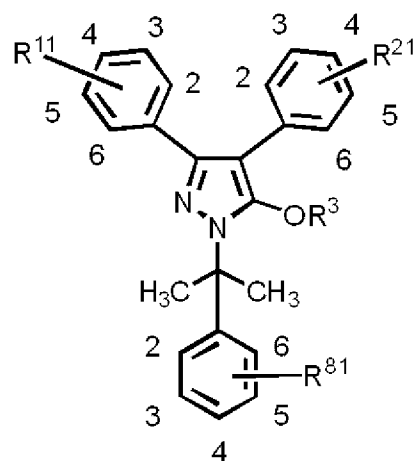
A042	H	A038	H	CH ₂ Ph
A042	H	A038	H	C(O)Ph
A042	H	A041	H	H
A042	H	A041	H	CH ₃
A042	H	A041	H	CH ₂ Ph
A042	H	A041	H	C(O)Ph
A042	H	A042	H	H
A042	H	A042	H	CH ₃
A042	H	A042	H	CH ₂ Ph
A042	H	A042	H	C(O)Ph
A042	H	A043	H	H
A042	H	A044	H	H

第 1 3 表

表中、置換基R¹¹、R²¹及びR⁸¹の置換位置を表す番号は、それぞれ下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものである。

[0174]

[化48]



[0175]

R ¹¹	R ²¹	R ⁸¹	R ³
H	H	H	H
H	4-CH ₃	H	H
H	4-t-Bu	H	H
H	4-t-Bu	4-CH ₃	H
H	4-t-Bu	H	CH ₃
H	4-t-Bu	4-CH ₃	CH ₃
H	4-n-Hex	H	H
H	4-n-Hex	4-Cl	H

H	4-n-Hex	4-Br	H
H	4-n-Hex	4-CH ₃	H
H	4-n-Hex	H	CH ₃
H	4-n-Hex	4-CH ₃	CH ₃
H	4-n-Hex	H	CH ₂ Ph
H	4-n-Hex	H	C(O)OEt
H	4-n-Hex	H	C(O)Ph
H	4-Ph	H	H
H	4-Ph	4-CH ₃	H
H	4-Ph	H	CH ₃
H	4-Ph	4-CH ₃	CH ₃
4-F	H	H	H
2-Cl	H	H	H
3-Cl	H	H	H
4-Cl	H	H	H
4-Cl	4-t-Bu	H	H
4-Cl	4-t-Bu	4-CH ₃	H
4-Cl	4-n-Hex	H	H
4-Cl	4-n-Hex	4-Cl	H
4-Cl	4-n-Hex	4-Br	H
4-Cl	4-n-Hex	4-CH ₃	H
4-Cl	4-Ph	H	H
4-Cl	4-Ph	4-CH ₃	H
4-Br	H	H	H

[0176] 第 1 3 表 (続き)

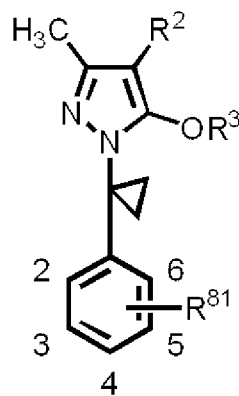
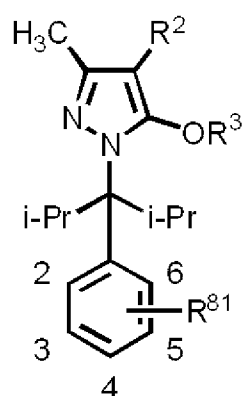
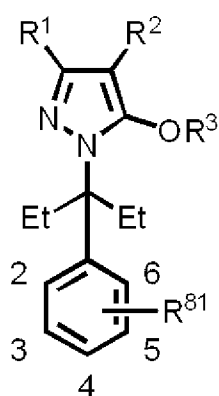
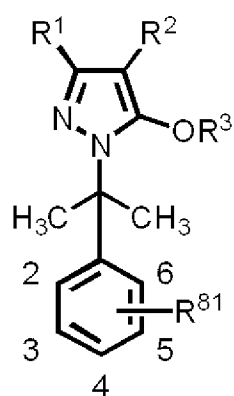
R¹¹R²¹R⁸¹R³

3, 4-Cl ₂	H	H	H
4-NO ₃	H	H	H
4-CN	H	H	H
2-CH ₃	H	H	H
3-CH ₃	H	H	H
4-CH ₃	H	H	H
4-CH ₃	4-t-Bu	H	H
4-CH ₃	4-t-Bu	4-CH ₃	H
4-CH ₃	4-n-Hex	H	H
4-CH ₃	4-n-Hex	4-Cl	H
4-CH ₃	4-n-Hex	4-Br	H
4-CH ₃	4-n-Hex	4-CH ₃	H
4-CH ₃	4-Ph	H	H
4-CH ₃	4-Ph	4-CH ₃	H
3, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
4-OCH ₃	H	H	H
4-OCH ₃	4-t-Bu	H	H
4-OCH ₃	4-n-Hex	H	H
4-OCH ₃	4-n-Hex	4-Cl	H
4-OCH ₃	4-n-Hex	4-Br	H
4-OCH ₃	4-n-Hex	4-CH ₃	H
4-OCH ₃	4-Ph	H	H
3, 4-(OCH ₃)	H	H	H
4-Ph	H	H	H

第 1 4 表

表中、置換基R⁸¹の置換位置を表す番号は、それぞれ下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものであり、一の表記は、無置換を表す。

[0177] [化49]



[0178] -----

R ¹	R ²	(Z) _m	R ⁸¹	R ³
H	H	-	H	H
Et	H	-	H	H
n-Pr	H	-	H	H
n-Bu	H	-	H	H
c-Bu	H	-	H	H
n-Pen	H	-	H	H
c-Pen	H	-	H	H
CF ₃	H	-	H	H
CF ₃	H	-	4-CH ₃	H
CF ₃	H	-	4-CH ₃	CH ₃

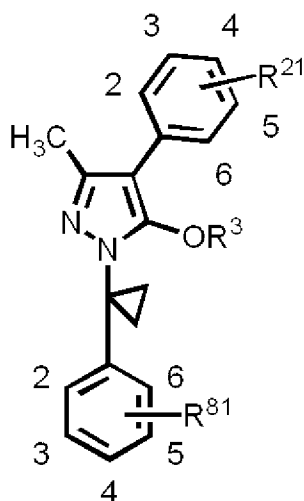
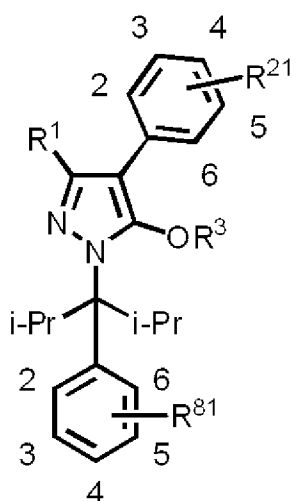
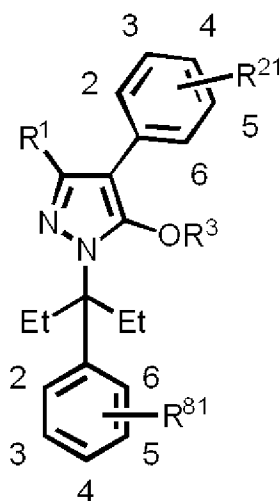
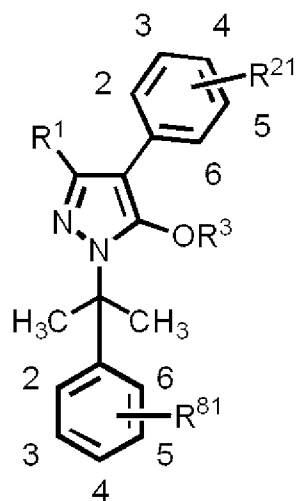
CF ₃	A005	—	H	H
CF ₃	A006	—	H	H
CF ₃	A014		H	H
CF ₃	A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H
CF ₃	A036	H	H	H
CF ₃	A037	—	H	H
CF ₃	A038	—	H	H
CF ₃	A041	—	H	H
CF ₃	A042	—	H	H
CN	H	—	H	H
C(=O)OEt	H	—	H	H
Ph	H	—	H	H
(4-CH ₃)Ph	H	—	H	H
(4- <i>i</i> -Pr)Ph	H	—	H	H
(4-OCH ₃)Ph	H	—	H	H
(4-OCH ₃)Ph	H	—	4-CH ₃	H

第 15 表

表中、置換基R²¹及びR⁸¹の置換位置を表す番号は、それぞれ下記の構造式に於いて記された番号の位置に対応するものであり、—の表記は、無置換を表す。

[0179]

[化50]



[0180]

R¹	(Z) _m	R²¹	R⁸¹	R³
H	—	H	H	H
Et	—	H	H	H
n-Pr	—	H	H	H
n-Bu	—	H	H	H
CF₃	—	H	H	H
CF₃	—	4-CH₃	H	H
CF₃	—	4-CH₃	4-CH₃	H

CF ₃	—	4-CH ₃	4-CH ₃	CH ₃
CF ₃	—	4-t-Bu	H	H
CF ₃	—	4-n-Hex	4-CH ₃	H
CF ₃	—	4-n-Hex	4-CH ₃	CH ₃
CF ₃	—	4-Ph	H	H
CO ₂ Et	—	H	H	H
A001	H	H	H	H
A002	H	H	H	H
A003	H	H	H	H
A005	H	H	H	H
A005	2, 5-(CH ₃) ₂	H	H	H
A005	2, 5-Cl ₂	H	H	H
A005	2-Br	H	H	H
A006	H	H	H	H
A006	3-CH ₃	H	H	H
A006	5-CH ₃	H	H	H
A006	3-Cl	H	H	H
A006	5-Et	H	H	H
A006	5-Cl	H	H	H
A006	5-Br	H	H	H
A006	3-Br	H	H	H
A006	4-Br	H	H	H
A006	5-NO ₂	H	H	H
A007	H	H	H	H
A007	5-CH ₃	H	H	H
A007	3-CH ₃	H	H	H
A007	5-Br	H	H	H
A007	5-NO ₂	H	H	H

A007	5-Ph	H	H	H
A008	5-CH ₃	H	H	H
A009	5-CH ₃	H	H	H
A010	3, 5-(CH ₃) ₂	H	H	H
A010	3, 5-Cl ₂	H	H	H
A011	3, 5-(CH ₃) ₂	H	H	H
A011	3, 5-Cl ₂	H	H	H
A012	3-CH ₃	H	H	H
A012	3-CH ₃	H	H	H
A012	3-Cl	H	H	H
A013	3-CH ₃	H	H	H

[0181] 第 1 5 表 (続き)

R ¹	(Z) _m	R ²¹	R ⁸¹	R ³
A013	3-CH ₃	H	H	H
A013	3-Cl	H	H	H
A014	H	H	H	H
A015	H	H	H	H
A016	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
A017	2, 4-(CH ₃) ₂	H	H	H
A034	H	H	H	H
A034	3, 6-Cl ₂	H	H	H
A035	H	H	H	H
A036	H	H	H	H
A037	H	H	H	H
A037	6-OCH ₃	H	H	H
A037	6-Br	H	H	H

A038	H	H	H	H
A038	2-OCH ₃	H	H	H
A038	4-OCH ₃	H	H	H
A038	4-F	H	H	H

実施例

[0182] 以下に本発明化合物の合成例、試験例を実施例として具体的に述べることで、本発明をさらに詳しく説明するが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

以下の合成例で得られた化合物において、同定はプロトン核磁気共鳴 (¹H NMR) により行った。なお、ケミカルシフト値 (δ 値) は基準物質としてテトラメチルシラン (Me₄Si) を用いた。

[0183] [合成例]

合成例 1

4-(4-hexylphenyl)-3-isopropyl-1-(2-methyl-1-p-tolylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-5-ol (本発明化合物No. 3-07)

工程 1 ;

Triphenyl(t-butoxycarbonylimino)phosphoraneの合成

カルバジン酸t-ブチル 25 g (0.19 mol) を酢酸 80 mL 及び水 160 mL に溶解させ、氷冷下、亜硝酸ナトリウム 15 g (0.22 mol) を少量ずつ分割して添加した。氷冷下 30 分攪拌した後、ジイソプロピルエーテル 250 mL にて抽出し、有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 200 mL で 2 回、飽和食塩水 100 mL で 1 回順次洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで脱水・乾燥し、ろ過して t-butyl carbonazidate のジエチルエーテル溶液を得た。

上記のようにして得られた t-butyl carbonazidate のジエチルエーテル溶液に、氷冷下でトリフェニルホスフィン 49.6 g (0.189 mol) を少量ずつ加え、室温下で、1 時間攪拌した後、析出した固体をろ取した。得られた固体をヘキサン 200 mL で洗浄後、減圧下乾燥することで、目的物 67 g を白色結晶として得

た。

工程 2 ;

t-Butyl 3-(trichloromethyl)-1,2-oxaziridine-2-carboxylate の合成

Triphenyl(t-butoxycarbonylimino)phosphorane 20.0 g (53.0 mol) をトルエン 80 mL に懸濁させ、無水クロラル 8.84 g (60.0 mmol) を加えて、120°C で 4 時間加熱還流した。放冷後、ヘキサン 300 mL を加えて、生じた白色固体をろ別し、ろ液を減圧下濃縮することで、茶色液体を得た。これをクロロホルム 200 mL に溶解させ、氷冷下、氷冷した炭酸カリウム 3.74 g (50.0 mmol) の水 20 mL 溶液及び氷冷した OXONE (2KHSO₅ · KHSO₄ · K₂SO₄、デュポン社から供給されたもの) 4.94 g (15 mmol) の水 40 mL 溶液を同時に加えて 1 時間攪拌する操作を 3 度繰り返した。水層を取り除いた後、氷冷下、同様の炭酸カリウム水溶液と OXONE 水溶液を同時に加えて 1 時間攪拌する操作を 3 度繰り返した。再度、水層を取り除いた後、氷冷下、同様の炭酸カリウム水溶液と OXONE 水溶液を同時に加えて 1 時間攪拌する操作を 3 度繰り返した。水層を除去し、氷冷した炭酸カリウム 11.2 g (150 mmol) の水 60 mL 溶液及び氷冷した OXONE 14.8 g (45 mmol) の水 120 mL 溶液を氷冷下で同時に加え、1 時間攪拌した。水層を取り除いた後、氷冷下、同様の炭酸カリウム水溶液と OXONE 水溶液を同時に加えて 1 時間攪拌した。再度、水層を取り除いた後、氷冷下、同様の炭酸カリウム水溶液と OXONE 水溶液を同時に加えて 1 時間攪拌した。水層を除いた後、クロロホルム層を無水硫酸ナトリウムで脱水・乾燥し、ろ過後、減圧下濃縮した。得られた残渣をヘキサノー酢酸エチル {100:0 (体積比、以下同じである) ~ 80:20} で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 10.3 g を淡黄色オイルとして得た。

工程 3 ;

2-chloro-N-(2-methyl-1-p-tolylpropan-2-yl)acetamide の合成

2-methyl-1-p-tolylpropan-2-ol 8.21 g, (50 mmol) と酢酸 12.0 mL をクロロアセトニトリル 11.3 g (0.15 mol) に溶解させ、氷冷下、硫酸 12.0 mL (0.15 mol) を加えた。室温で 5 時間攪拌した後、反応液を氷水 200 mL へ注ぎ、ジ

イソプロピルエーテルで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水及び飽和塩化ナトリウム水溶液で順次洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで脱水・乾燥し、ろ過後、ろ液を減圧濃縮することで、目的物10.8 gを白色結晶として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.11 (d, $J = 7.7\text{Hz}$, 2H), 7.03 (d, $J = 8.3\text{Hz}$, 2H), 6.24 (br, 1H), 3.94 (s, 2H), 2.98 (s, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.37 (s, 6H) z z

[0184] 工程 4 ;

2-methyl-1-p-tolylpropan-2-amineの合成

2-chloro-N-(2-methyl-1-p-tolylpropan-2-yl)acetamide 6.24 g (26.0 mmol) とチオ尿素 1.98 g (26.0 mmol) をエタノール 50 mL に溶解させ、室温で酢酸 10.2 mL を滴下した。85 °C で、3 時間攪拌した後、生じた白色懸濁液を放冷し、水 300 mL を加えて希釈した。20 重量% 水酸化ナトリウム水溶液で、反応液をアルカリ性にした後、ヘキサンで抽出し、飽和塩化ナトリウム水溶液で洗浄後、有機層を減圧濃縮することで、目的物 4.04 g を黄緑色液体として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.02-7.13 (m, 4H), 2.61 (s, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.18 (br, 2H), 1.16 (s, 6H)

工程 5 ;

t-butyl 2-(2-methyl-1-p-tolylpropan-2-yl)hydrazinecarboxylateの合成

別途調製した 2-methyl-1-p-tolylpropan-2-amine 2.40 g (14.7 mmol) を塩化メチレン 20 mL に溶解させ、氷冷下、別途調製した t-butyl 3-(trichloromethyl)-1,2-oxaziridine-2-carboxylate 2.60 g (10.0 mmol) を塩化メチレン 10 mL に溶解させて加えた。氷冷下で 30 分、室温で 1 時間攪拌後、減圧下塩化メチレンを除去した。得られた残渣をヘキサノン酢酸エチル (100:0 ~ 0:100) で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 1.61 g を無色結晶として得た。

工程 6 ;

2-(4-hexylphenyl)-1-morpholinoethanethioneの合成

1-(4-hexylphenyl)ethanone 5.0 g (25 mmol) をモルホリン 2.13 g (24.5 mmol) に溶解させ、硫黄 1.33 g (41.6 mmol) を加えて 115°C で 5 時間加熱還流した。反応終了後、室温に戻し、メタノールを添加し、結晶として析出した反応生成物をろ取、洗浄、乾燥して目的物 4.50 g を淡黄色結晶として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.11~7.26 (m, 4H), 4.3~4.5 (m, 4H), 3.6~3.9 (m, 4H) 3.35~3.48 (m, 2H), 2.55~2.60 (m, 2H), 1.51~1.70 (m, 2H), 1.23~1.42 (m, 6H), 0.82~1.01 (m, 3H)

工程 7 ;

2-(4-hexylphenyl)acetic acidの合成

1-(4-hexylphenyl)ethanone 12.0 g (39.3 mmol) を氷酢酸 23.6 g (393 mmol) に溶解させ、水 4.95 g (275 mmol) 及び硫酸 5.79 g (58.9 mmol) を加えて 150°C で 6.5 時間加熱還流した。反応終了後、水 400 mL で希釈し、酢酸エチルにて抽出した。得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで脱水・乾燥後、ろ過し、減圧下濃縮した。得られた残渣を酢酸エチル:ヘキサン (1:20~1:4) にて溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 5.74 g を白色結晶として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.08~7.21 (m, 4H), 3.61 (s, 2H), 2.55~2.61 (m, 2H), 1.51~1.67 (m, 2H), 1.20~1.41 (m, 6H), 0.86~0.90 (m, 3H)

工程 8 ;

ethyl 2-(4-hexylphenyl)acetateの合成

2-(4-hexylphenyl)acetic acid 5.5 g (25 mmol) をエタノール 11 mL に溶解させ、硫酸 1.1 g (11.2 mmol) を加えて 60°C で 1 時間攪拌した。冷却した炭酸ナトリウム飽和水溶液 (100 mL) を加えて反応停止後、反応溶液を酢酸エチルにて抽出した。得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで脱水・乾燥後、ろ過し、減圧下濃縮し、目的物 5.68 g を淡黄色オイルとして得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.06~7.22 (m, 4H), 4.14 (q, $J = 7.2\text{Hz}$,

2H), 3.57 (s, 2H), 2.58 (t, J = 7.8Hz, 2H), 1.50~1.65 (m, 2H), 1.1~1.4 (m, 6H), 1.25 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.82~0.92 (m, 3H)

[0185] 工程 9 ;

ethyl 2-(4-hexylphenyl)-4-methyl-3-oxopentanoateの合成

窒素雰囲気下、ethyl 2-(4-hexylphenyl)acetate 6.0 g (24 mmol) を脱水テトラヒドロフラン 130 mL に溶解させ、-60℃まで冷却した。この溶液にリチウムジイソプロピルアミンヘキサン/テトラヒドロフラン 1.14 M 溶液 31.8 mL (36.2 mmol) を添加し、0℃まで昇温後 1 時間攪拌した。再び -60℃まで冷却後、isobutyryl chloride 3.6 g (34 mmol) を添加し、-60℃~室温で 15 時間攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (150 mL) を加えて反応停止後、反応溶液を酢酸エチルにて抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで脱水・乾燥後、ろ過し、減圧下濃縮した。得られた残渣を酢酸エチル:ヘキサン (0:100~1:9) で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 5.39 g を淡黄色オイルとして得た。

¹H NMR (CDCl₃, Me₄Si, 300MHz) δ 7.11~7.33 (m, 4H), 4.84 (s, 1H), 4.19 (d, J = 7.1Hz, 2H), 2.67~2.81 (m, 1H), 2.59 (t, J = 7.8Hz, 2H), 1.50~1.71 (m, 2H), 1.22~1.42 (m, 6H), 1.27 (d, J = 7.1Hz, 3H), 1.12 (d, J = 6.8Hz, 3H), 1.01 (d, J = 6.8Hz, 3H), 0.81~0.95 (m, 3H)

工程 10 ;

4-(4-hexylphenyl)-3-isopropyl-1-(2-methyl-1-p-tolylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-5-ol (本発明化合物 No. 3-07) の合成

t-butyl 2-(2-phenylpropan-2-yl)hydrazinecarboxylate 200 mg (0.72 mmol) を塩化メチレン 3 mL に溶解させ、パラトルエンスルホン酸一水和物 251 mg (1.3 mmol) を加えて室温で 23 時間攪拌した。反応溶液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (50 mL) で塩基性とし、分液にて得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、ろ過し、減圧下濃縮した。得られた残渣をトルエン 0.80 mL 及び酢酸 35 μL に溶解させ、別途調製した ethyl 2-(4-hexylphenyl)-4-methyl-3-oxopentanoate 226 mg (0.71 mmol) を加えて 90℃で 8 時間攪拌した。室温まで

冷却後、酢酸エチルで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで脱水・乾燥し、ろ過後、減圧下濃縮した。得られた残渣をヘキサン-酢酸エチル(1:20~1:3)で溶出する中圧シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物130 mgを淡黄色固体として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.18~7.42 (m, 4H), 7.00 (s, 4H), 3.21 (s, 2H), 3.16 (sep, $J = 7.2\text{Hz}$, 1H), 2.61 (t, $J = 7.5\text{Hz}$, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.62 (s, 6H), 1.54~1.58 (m, 2H), 1.26~1.36 (m, 6H), 1.07 (d, $J = 7.2\text{Hz}$, 6H), 0.87~0.92 (m, 3H)

[0186] 合成例 2

1-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-3-phenyl-1H-pyrazol-5(4H)-one (本発明化合物No. 3-16)

工程 1 ;

1-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-2-(propan-2-ylidene)hydrazineの合成

Acetone azine (1.50 g, 13.4 mmol)をジエチルエーテル 10 mLに溶解させ、benzylmagnesium bromide 0.6 Mテトラヒドロフラン溶液32 mL(19.2 mmol)を添加し、45℃で24時間攪拌した。飽和塩化アンモニウム水溶液 (100mL)を加えて反応停止後、反応溶液を酢酸エチルにて抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで脱水・乾燥後、ろ過し、減圧下濃縮した。得られた残渣をヘキサン-酢酸エチル(9:1~6:1)で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物710 mgを淡黄色オイルとして得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.03~7.28 (m, 5H), 4.2~4.4 (m, 1H), 2.78 (s, 2H), 1.99 (s, 3H), 1.62 (s, 3H), 1.18 (s, 6H)

工程 2 ;

1-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-3-phenyl-1H-pyrazol-5(4H)-one (本発明化合物No. 3-16) の合成

1-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-2-(propan-2-ylidene)hydrazine 500 mg(2.45 mmol)を氷酢酸3.0 mLに溶解させ、ethyl 3-oxo-3-phenylpropanoate 429 mg(2.23 mmol)を加えて100℃で4時間攪拌した。室温に戻し、酢酸エチ

ルで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（100ml）で中和した。反応溶液を酢酸エチルにて抽出し、得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで脱水・乾燥後、ろ過し、減圧下濃縮した。得られた残渣をヘキサン-酢酸エチル（100:1~9:1）で溶出するシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、目的物 330 mgを淡橙色固体として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.12~7.62 (m, 10H), 3.59 (s, 2H), 3.19 (s, 2H), 1.59 (s, 6H)

[0187] 合成例 3

3-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-1-(2-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-5(4H)-one（本発明化合物No. 3-04）の合成

工程 1 ;

2,2-dimethyl-3-phenylpropanoic acidの合成

ヘキサメチルジシラザン（34 g、0.21 mol）をテトラヒドロフラン（280 mL）に溶解させ、 -78°C で、1.67 Mのn-ブチルリチウムヘキサン溶液（127 mL、0.21 mol）を滴下した後、1時間かけて 0°C まで昇温した。反応液を再び -78°C に冷却し、benzyl isobutyrate（25 g、0.14 mol）のテトラヒドロフラン（70 mL）溶液を滴下し、 -78°C で1時間攪拌した。同温度にて、さらにクロロトリメチルシラン（36 mL、0.12 mol）を滴下し、1時間攪拌した後、室温に昇温した後、19時間攪拌を継続した。反応終了後、該反応溶液を減圧下にて溶媒を一部留去し、得られた白色懸濁液に、ヘキサン（200 mL）を添加した後、窒素雰囲気下でセライトろ過を行い、該反応液中の白色固体を除去した。ろ液を減圧下にて留去し、得られた淡黄色オイルを、 100°C で2時間加熱することで、茶色オイルが得られた。得られた茶色オイルに、1 M塩酸10 mLを添加し、 60°C で4時間攪拌した後に、飽和炭酸水素ナトリウムで中和し、酢酸エチル（100 mL $\times$ 2）、クロロホルム（100 mL $\times$ 2）で抽出した。得られた有機相を濃縮し、中圧シリカゲルカラムクロマトグラフィー（シリカゲル80 g、酢酸エチル100%）にて精製し、目的物 8

． 4.1 g を白色結晶として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.20–7.30 (m, 3H), 7.16 (d, $J = 7.1$ Hz, 2H), 2.89 (s, 2H), 1.21 (s, 6H)

工程 2 ;

2,2-dimethyl-3-phenylpropanoyl chlorideの合成

2,2-dimethyl-3-phenylpropanoic acid (4.0 g、0.023 mol) に塩化チオニル (2.97 g、0.025 mol) を室温で少しずつ加え、70℃で3時間攪拌した。室温でさらに、15時間攪拌した後、反応溶液を分留 (113–115℃、5 mmHg) することで、目的物 2.89 g を無色液体として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.20–7.30 (m, 3H), 7.18 (d, $J = 7.1$ Hz, 2H), 2.97 (s, 2H), 1.28 (s, 6H)

[0188] 工程 3 ;

ethyl 4,4-dimethyl-3-oxo-5-phenylpentanoateの合成

ethyl 3-oxobutanoate (1.09 g、8.3 mmol) の塩化メチレン (16 mL) 溶液に、無水塩化マグネシウム (158 mg、1.66 mmol) を添加した後、反応液を0℃にまで冷却し、ピリジン (1.34 mL、16.6 mmol) を添加し、30分攪拌した。同温度で、2,2-dimethyl-3-phenylpropanoyl chloride (1.64 g、8.3 mmol) を添加し、さらに30分攪拌した後に、室温にまで昇温し、20時間攪拌した。塩化メチレンを減圧にて留去した後、エタノール (2 mL) を添加し、室温で2日間した。その後、さらにトルエン (2 mL) を添加し、60℃で5時間を継続した。反応終了後、該反応溶液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄した後、酢酸エチル (50 mL $\times$ 2) にて抽出した。得られた有機層を減圧下にて溶媒を留去し、得られた茶色オイルを中圧シリカゲルカラムクロマトグラフィー (シリカゲル 12 g、酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 19 ~ 1 : 9) にて精製することで、目的物 370 mg を淡褐色オイルとして得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.18–7.32 (m, 3H), 7.10 (d, $J = 7.1$ Hz,

2H), 4.18 (q, $J = 7.1$ Hz, 3H), 3.46 (s, 2H), 2.83 (s, 2H), 1.29 (t, $J = 7.1$ Hz, 3H), 1.15 (s, 6H)

工程 4 ;

3-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-1-(2-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-5(4H)-one (本発明化合物No.3-04) の合成

tert-butyl 2-(2-phenylpropan-2-yl)hydrazinecarboxylate (250 mg、1.00 mmol) を塩化メチレン(2 mL) に溶解させ、p-トルエンスルホン酸一水和物(0.40 g、2.1 mmol) を添加し、室温で16時間攪拌した。攪拌終了後、該反応溶液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄することにより、反応を停止させた。分液後に得られた有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥・ろ過し、減圧下にて濃縮した。得られた残渣をトルエン(3.0 mL)、酢酸(70 μ L) に溶解させ、ethyl 4,4-dimethyl-3-oxo-5-phenylpentanoate (248 mg、1.00 mmol) を添加し、90℃で3時間攪拌した。反応終了後、室温まで放冷した後、酢酸エチルを添加した。得られた有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過し、減圧下にて濃縮した。得られた残渣を中圧シリカゲルカラムクロマトグラフィー(シリカゲル12 g、酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 9 ~ 3 : 7) にて精製し、目的物42 mg を褐色オイルとして得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.15-7.34 (m, 8H), 6.98-7.10 (m, 2H), 3.08 (s, 2H), 2.79 (s, 2H), 1.84 (s, 6H), 1.18 (s, 6H)

[0189] 合成例 4

5-methoxy-3-phenyl-1-(2-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazole (本発明化合物No.3-13) と 5-methoxy-4-methyl-3-phenyl-1-(2-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazole (本発明化合物No.3-14) の合成

3-phenyl-1-(2-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-5-ol (83 mg、0.30 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド(3.0 mL) に溶解し、室温にて55重量%水素化ナトリウム(鉱油中に分散)(26 mg、0.60

mmol) を添加した。室温で1時間攪拌した後、ヨウ化メチル (18 μ L、0.30 mmol) を滴下し、さらに同温度で、18時間攪拌を継続した。該反応溶液に水を添加して反応を停止した後、酢酸エチル (10 mL $\times$ 2回) にて抽出した。得られた有機相を飽和食塩水 (10 mL) で洗浄した後、減圧下にて濃縮した。得られた残渣を中圧シリカゲルカラムクロマトグラフィー (シリカゲル12 g、ヘキサン100%) にて精製し、5-methoxy-3-phenyl-1-(2-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazole 35 mg を無色固体として、5-methoxy-4-methyl-3-phenyl-1-(2-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazole 10 mg を無色オイルとして、それぞれ得た。

5-methoxy-3-phenyl-1-(2-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazole

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.83 (d, J = 7.4 Hz, 2H), 7.38 (t, J = 7.4 Hz, 2H), 7.15–7.33 (m, 4H), 7.08 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 5.91 (s, 1H), 3.60 (s, 3H), 1.98 (s, 6H)

5-methoxy-4-methyl-3-phenyl-1-(2-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazole

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.73 (d, J = 7.4 Hz, 2H), 7.41 (t, J = 7.4 Hz, 2H), 7.16–7.36 (m, 4H), 3.16 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.98 (s, 6H)

[0190] 合成例 5

1-(1-(4-bromophenyl)-2-methylpropan-2-yl)-3-isopropyl-1H-pyrazol-5(4H)-one (本発明化合物No. 3-12) の合成

1-(2,2-dimethyl-1,1-diphenylpropyl)-2-(propan-2-ylidene)hydrazine (147 mg、0.500 mmol) のテトラヒドロフラン (5 mL) 溶液に、 -78°C にて1.61 Mの *n*-ブチルリチウムヘキサン溶液 (0.37 mL、0.60 mmol) を滴下し、同温度で1時間攪拌した後、*p*-ブロモベンジルブロミド (125 mg、0.50 mmol) を滴下した。同温度で1時間攪拌を継続した後、室温まで昇温し、さらに室温下にて18時間攪拌した。該反应用液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を添加して反応を停止した後、酢酸エチル (10 mL $\times$ 3) にて抽出した。得られた有機層を減圧に

て濃縮した。得られた残渣をエタノール 2 mL に溶解させ、トリフルオロ酢酸 (1 mL) を添加し、室温にて 24 時間攪拌した。攪拌終了後、該反応溶液にさらに濃塩酸 (3 mL) を添加し、80℃で 5 時間攪拌した。攪拌終了後、該反応溶液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で中和した後、塩化メチレンで抽出した。得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥・ろ過し、減圧下にて濃縮した。得られた残渣をトルエン (3.0 mL) 及び酢酸 (70 μ L) に溶解し、イソブチリル酢酸メチル (72 mg、0.50 mmol) を添加し、90℃で 3 時間攪拌した。室温まで放冷した後、該反応溶液を酢酸エチルで希釈し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥・ろ過し、減圧下にて濃縮した。得られた残渣を中圧シリカゲルカラムクロマトグラフィー (シリカゲル 12 g、酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 9 ~ 3 : 7) にて精製し、目的物 15 mg を褐色オイルとして得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.35 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.98 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 3.14 (s, 2H), 3.06 (s, 2H), 2.59 (sep, J = 6.8 Hz, 1H), 1.50 (s, 6H), 1.10 (d, J = 7.1 Hz, 6H)

[0191] 合成例 6

ethyl 5-hydroxy-3-isopropyl-1-(2-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazole-4-carboxylate (本発明化合物No. 4-27) の合成

3-isopropyl-1-(2-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-5(4H)-one (1.22 g、5.00 mmol) 及び水酸化カルシウム (435 mg、7.50 mmol) をジオキサン (20 mL) に懸濁させ、45℃に加熱し、1 時間攪拌した。攪拌終了後、室温まで放冷した後、該反応溶液にクロロギ酸エチル (597 mg、5.50 mmol) を滴下した後、90℃で 6 時間攪拌した。反応終了後、得られた淡褐色懸濁液を、氷冷した 3 M 塩酸に投入した後、クロロホルム (20 mL $\times$ 5 回) にて抽出した。得られた有機相を、0.06 M 塩酸 (50 mL $\times$ 2) で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥・ろ過し、減圧下にて濃縮した。得られた残渣を中圧シリカゲルカラムクロマトグラ

フィー（シリカゲル40g、酢酸エチル：ヘキサン＝1：19～1：9）にて精製し、目的物650mgを黄色オイルとして得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 9.71 (s, 1H), 7.13-7.33 (m, 3H), 7.05-7.12 (m, 2H), 4.31 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 3.23 (sep, J = 6.9 Hz, 1H), 1.94 (s, 6H), 1.36 (t, 7.3 Hz, 3H), 1.30 (d, J = 6.8 Hz, 6H)

[0192] 合成例 7

methyl 2-(5-oxo-1-(2-phenylpropan-2-yl)-4,5-dihydro-1H-pyrazol-3-yl)acetate (本発明化合物No.4-01) の合成

tert-butyl 2-(2-phenylpropan-2-yl)hydrazinecarboxylate (250mg、1.00mmol)を塩化メチレン(2mL)に溶解させ、p-トルエンスルホン酸一水和物(0.40g、2.1mmol)を添加し、室温にて18時間攪拌した。反応溶液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で塩基性とし、分液後に得られた有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥・ろ過し、減圧下にて濃縮した。得られた残渣をトルエン(2.0mL)及び酢酸(70 μ L)に溶解させ、1,3-アセトンジカルボン酸ジメチル(174mg、1.00mmol)を添加し、90℃で3時間攪拌し、さらに105℃で3時間攪拌した。反応終了後、室温まで放冷した後、該反応溶液を酢酸エチルで希釈した。得られた有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過し、減圧下にて濃縮した。得られた残渣を中圧シリカゲルカラムクロマトグラフィー（シリカゲル12g、酢酸エチル：ヘキサン＝1：9～3：7）にて精製し、目的物96.3mgを白色固体として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.18-7.34 (m, 5H), 3.75 (s, 3H), 3.48 (s, 2H), 3.41 (s, 2H), 1.87 (s, 6H)

[0193] 合成例 8

4-bromo-3-isopropyl-1-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-5(4H)-one (本発明化合物No.3-47) の合成

3-isopropyl-1-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-5(4H)-one (

1. 2 g、4. 6 mmol)をN, N-ジメチルホルムアミド(35 mL)に溶解させ、N-ブロモスクシンイミド(908 mg、5. 10 mmol)を加えて室温で30分攪拌した。反応溶液を酢酸エチルにて抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮した。得られた残渣をヘキサン懸濁洗浄にて精製し、目的物1. 26 gを淡青色固体として得た

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.06-7.29 (m, 5H), 4.64 (s, 1H), 3.12 (d, $J = 13.4$ Hz, 1H), 3.03 (d, $J = 13.4$ Hz, 1H), 2.73-2.88 (m, 1H), 1.53 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.16 (d, $J = 6.9$ Hz, 3H), 1.13 (d, $J = 7.2$ Hz, 3H)

[0194] 合成例9

methyl 4-(5-hydroxy-3-isopropyl-1-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-4-yl)benzoate (本発明化合物No.4-23) の合成

4-bromo-3-isopropyl-1-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl benzoate (360 mg、0. 82 mmol)の1, 2-ジメトキシエタン(4. 8 mL)溶液に、4-(methoxycarbonyl)phenylboronic acid (164 mg、0. 911 mmol)、Tetrakis(triphenylphosphine)palladium (80 mg、0. 07 mmol)及び2M炭酸ナトリウム水溶液(3. 6 mL)を添加し、窒素雰囲気下86℃で16時間攪拌した。反応終了後、1, 2-ジメトキシエタンを減圧にて留去した後、ジクロロメタンにて抽出した。得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥・ろ過し、減圧下もて濃縮した。得られた残渣を中圧シリカゲルカラムクロマトグラフィー(シリカゲル12 g、酢酸エチル：ヘキサン=1：20～1：4)にて精製し、目的物100 mgを淡黄色固体の互変異性体混合物として得た

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.0-8.1 (m, 2H), 7.6-7.7 (m, 2H), 7.15-7.3 (m, 3H), 7.05-7.15 (m, 2H), 6.37 (br, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.27 (s, 2H), 3.12-3.19 (m, 1H), 1.65 (s, 6H), 1.08 (d, $J = 7.2$ Hz, 6H)

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 8.0-8.1 (m, 2H), 7.6-7.7 (m, 2H), 7.15-7.3 (m, 3H), 7.05-7.15 (m, 2H), 4.2-4.3 (m, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.1-3.2

(m, 2H), 2.35-2.5 (m, 1H), 1.65 (s, 6H), 0.95-1.05 (m, 6H)

[0195] 合成例 1 O

(5-hydroxy-3-isopropyl-1-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-4-yl)(phenyl)methanone (本発明化合物No. 4-71)

工程 1 ;

4-bromo-3-isopropyl-1-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl benzoateの合成

4-bromo-3-isopropyl-1-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-5(4H)-one (3.00 g, 8.90 mmol)をテトラヒドロフラン39 mLに溶解し、氷浴で0℃まで冷却し、トリエチルアミン1.80 g (17.8 mmol)、ベンゾイルクロリド1.38 g (9.82 mmol)の順に滴下し、窒素雰囲気下室温にて3時間攪拌した。蒸留水を加え反応を停止させた後、反応溶液を酢酸エチルにて抽出し、得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (シリカゲル12 g、酢酸エチル:ヘキサン=1:20) にて精製し、目的物3.34 gを黄色オイルとして得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.98-8.05 (m, 2H), 7.62-7.70 (m, 1H), 7.44-7.56 (m, 2H), 7.18-7.26 (m, 3H), 6.78-6.88 (m, 2H), 3.07 (s, 2H), 2.92-3.06 (m, 1H), 1.56 (s, 6H), 1.29 (d, $J = 6.9$ Hz, 6H)

工程 2 ;

(5-hydroxy-3-isopropyl-1-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-4-yl)(phenyl)methanone (本発明化合物No. 4-71) の合成

4-bromo-3-isopropyl-1-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-5-yl benzoate 1.60 g (3.63 mmol)をテトラヒドロフラン16 mLに溶解し、冷媒 (アセトン/ドライアイス) を用いて-60℃まで冷却し、1.63 M *n*-ブチルリチウム/*n*-ヘキサン溶液2.60 mL (4.24 mmol)を滴下し、窒素雰囲気下72℃にて4時間攪拌した。蒸留水を加え反応を停止させた後、反応溶液を酢酸エチルにて抽出し、得られた有機層を無水

硫酸マグネシウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（シリカゲル 12 g、酢酸エチル:ヘキサン = 1 : 20）にて精製し、目的物 520 mg を黄色オイルとして得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.15–7.63 (m, 8H), 6.90–6.98 (m, 2H), 3.17 (s, 2H), 2.60–2.74 (m, 1H), 1.64 (s, 6H), 0.96 (d, $J = 6.9$ Hz, 6H)

[0196] 合成例 11

4-(4-hexylphenyl)-5-hydroxy-1-(2-methyl-1-(p-tolyl)propan-2-yl)-1H-pyrazole-3-carbonitrile（本発明化合物No. 4-86）

工程 1 ;

ethyl 4-(4-hexylphenyl)-5-(methoxymethoxy)-1-(2-methyl-1-(p-tolyl)propan-2-yl)-1H-pyrazole-3-carboxylateの合成

ethyl 4-(4-hexylphenyl)-5-hydroxy-1-(2-methyl-1-(p-tolyl)propan-2-yl)-1H-pyrazole-3-carboxylate 152 mg (0.329 mmol) を N,N -ジメチルホルムアミド 1.6 mL に溶解し、氷冷下にて 60 重量% 水素化ナトリウム（鉱油中に分散）26 mg (0.65 mmol)、クロロメチルメチルエーテル 0.050 mL (0.66 mmol) の順に添加し、室温にて 3 時間攪拌した。反応終了後、反応混合物をジエチルエーテルで希釈し、1M 塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水にて順次洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮して目的物（粗収量 174 mg）を得た。

工程 2 ;

4-(4-hexylphenyl)-5-(methoxymethoxy)-1-(2-methyl-1-(p-tolyl)propan-2-yl)-1H-pyrazole-3-carboxylic acidの合成

ethyl 4-(4-hexylphenyl)-5-(methoxymethoxy)-1-(2-methyl-1-(p-tolyl)propan-2-yl)-1H-pyrazole-3-carboxylate (138 mg) をテトラヒドロフラン 2 mL 及びメタノール 0.7 mL に溶解し、5M 水酸化ナトリウム水溶液 0.27 mL (1.4 mmol) を添加し、室温にて 20 時間攪拌した。反応終了後、反応混合物を塩化メチレンで希釈し、飽和塩化アンモニウム水溶液で洗浄した。獲られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮して目的物（粗収量 142 mg）を得た。

)を得た。

工程 3 ;

4-(4-hexylphenyl)-5-(methoxymethoxy)-1-(2-methyl-1-(p-tolyl)propan-2-yl)-1H-pyrazole-3-carboxamideの合成

4-(4-hexylphenyl)-5-(methoxymethoxy)-1-(2-methyl-1-(p-tolyl)propan-2-yl)-1H-pyrazole-3-carboxylic acid (142 mg)をエタノール 1.4 mLに溶解し、純度90%の(4,6-ジメトキシ-1,3,5-トリアジン-2-イル)-4-メチルモルホリニウムクロリド 125 mg(0.407 mmol)を添加した。室温にて30分攪拌した後、アンモニアの 2M エタノール溶液0.54 mL(1.1 mmol)を添加し、1.5時間攪拌を継続した。反応終了後、減圧下にて溶媒を留去した後、酢酸エチルを添加した後、有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水にて順次洗浄した。獲られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮して化合物5 (粗収量171 mg)を白色アモルファスとして得た。

工程 4 ;

4-(4-hexylphenyl)-5-(methoxymethoxy)-1-(2-methyl-1-(p-tolyl)propan-2-yl)-1H-pyrazole-3-carbonitrile

4-(4-hexylphenyl)-5-(methoxymethoxy)-1-(2-methyl-1-(p-tolyl)propan-2-yl)-1H-pyrazole-3-carboxamide 171 mgを塩化メチレン 2 mLに溶解し、トリエチルアミン 0.3mL(2 mmol)を添加した。。氷浴で0℃まで冷却し、トリクロロアセチルクロリド 0.080 mL(0.72 mmol)を滴下し、室温にて1.5時間攪拌した。反応終了後、反応今後物に塩化メチレンを添加した後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水にて順次洗浄した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮して目的物(粗収量266 mg)を得た。

工程 5 ;

4-(4-hexylphenyl)-5-hydroxy-1-(2-methyl-1-(p-tolyl)propan-2-yl)-1H-pyrazole-3-carbonitrile (本発明化合物No.4-86)の合成

4-(4-hexylphenyl)-5-(methoxymethoxy)-1-(2-methyl-1-(p-tolyl)propan-

2-yl)-1H-pyrazole-3-carbonitrile 266 mgをテトラヒドロフラン4 mL及びメタノール 0.8 mLに溶解し、4M塩酸ジオキサン溶液 (0.70 mL、2.8 mmol)を添加し、室温にて14時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて溶媒を一部留去し、反応混合物中に析出した結晶をろ別し、得られた結晶をイソプロピルエーテルで洗浄した。イソプロピルエーテル溶液をろ液と併せ、減圧下にて濃縮し、得られた残渣を中圧シリカゲルカラムクロマトグラフィー (シリカゲル10 g、酢酸エチル : ヘキサン = 0 : 100 ~ 20 : 80) にて精製し、目的物88.1 mgを白色固体として得た。

融点140 - 142°C

[0197] 合成例 1 2

1-(5-hydroxy-3-isopropyl-1-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-4-yl)ethanone O-methyl oxime (本発明化合物No. 4-89)

1-(5-hydroxy-3-isopropyl-1-(2-methyl-1-phenylpropan-2-yl)-1H-pyrazol-4-yl)ethanone 150 mg (0.50 mmol)、メトキシアミン塩酸塩 209 mg (2.50 mmol) 及び酢酸ナトリウム 286 mg (3.49 mmol) に、蒸留水 1.3 mL 及びエタノール 1.3 mL を添加し、室温にて16時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を酢酸エチルにて抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (シリカゲル4 g、酢酸エチル : ヘキサン = 1 : 99) にて精製し、目的物70 mgを橙色オイルとして得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.12-7.22 (m, 3H), 6.84-6.95 (m, 2H), 3.87 (s, 3H), 3.16 (s, 2H), 2.98-3.12 (m, 1H), 2.25 (s, 3H), 1.57 (s, 6H), 1.21 (d, $J = 6.8$ Hz, 6H)

[0198] 合成例 1 3

4-(4-hexylphenyl)-1-(2-methyl-1-(p-tolyl)propan-2-yl)-1H-pyrazol-5-ol (本発明化合物No. 4-90)

工程 1 ; ethyl 3-(dimethylamino)-2-(4-hexylphenyl)acrylateの合成

ethyl 2-(4-hexylphenyl)acetate 0.50 g (2.0 mmol) を N,N-ジメチルホルムアミド 7 mL に溶解し、N,N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 0.31 mL (2.3 mmol) を添加し、60°C にて 18 時間攪拌した。攪拌終了後、さらに N,N-ジメチルホルムアミドジメチルアセタール 0.65 mL (4.9 mmol) を添加し、60°C にて 24 時間攪拌を継続した。反応終了後、反応混合物にジエチルエーテルを添加した後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水にて順次洗浄した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮して目的物を褐色液体として得た。

工程 2 ;

4-(4-hexylphenyl)-1-(2-methyl-1-(p-tolyl)propan-2-yl)-1H-pyrazol-5-ol (本発明化合物 No. 4-90) の合成

ethyl 3-(dimethylamino)-2-(4-hexylphenyl)acrylate と tert-butyl 2-(2-methyl-1-(p-tolyl)propan-2-yl)hydrazinecarboxylate 0.50 g (1.8 mmol) を酢酸 2 mL に溶解し、90°C にて 24 時間攪拌した。攪拌終了後、さらに酢酸 0.5 mL を添加し、48 時間攪拌を継続した。反応終了後、反応混合物を室温まで冷却した後、ジエチルエーテルを添加し、蒸留水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水にて順次洗浄した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮して得られた残渣を中圧シリカゲルカラムクロマトグラフィー (シリカゲル 30 g、酢酸エチル: ヘキサン = 0 : 100 ~ 35 : 65) にて精製した。得られた固体をイソプロピルエーテルで洗浄し、目的物 164 mg を白色固体として得た。

融点 149 - 151°C

[0199] 合成例 14

tert-butyl 2-(2-methyl-1-(4-(trifluoromethyl)phenyl)propan-2-yl)hydrazinecarboxylate の合成

工程 1 ;

1-(2-azido-2-methylpropyl)-4-(trifluoromethyl)benzene の合成

4-トリフルオロメチルフェニル酢酸 25 g (0.12 mol) にエタノール 300 mL

、濃硫酸(95%、5mL)を添加し、40℃にて16時間攪拌した。反応終了後、減圧下にてエタノールを留去し、酢酸エチルで希釈した後、蒸留水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水にて順次洗浄した。得られた有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮し、ethyl 2-(4-(trifluoromethyl)phenyl)acetate 27.9gの粗物を得た。

ethyl 2-(4-(trifluoromethyl)phenyl)acetate 27.9 gを脱水テトラヒドロフラン 150 mLに溶解し、窒素雰囲気下氷冷下にて0.99Mのメチルマグネシウムブロミドテトラヒドロフラン溶液280 mL(0.28 mol)を滴下し、室温にて2時間攪拌した。攪拌終了後、蒸留水を添加して反応を停止した。有機層を1M 塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水にて順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮して、2-methyl-1-(4-(trifluoromethyl)phenyl)propan-2-ol 26.3 gの粗物を得た。

2-methyl-1-(4-(trifluoromethyl)phenyl)propan-2-ol 26.3 gを塩化メチレン 400 mLに溶解し、氷冷下にてトリメチルシリルアジド 25 mL(0.19 mol)、三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体 24 mL(0.19 mol)の順に滴下し、室温にて20時間攪拌した。反応終了後、反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水にて順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮し、目的物 25.4 gを得た。

工程 2 ;

2-methyl-1-(4-(trifluoromethyl)phenyl)propan-2-amineの合成

1-(2-azido-2-methylpropyl)-4-(trifluoromethyl)benzene 25.4 gを酢酸エチル 210 mLに溶解し、20重量%水酸化パラジウム炭素 0.84 gを添加し、反応容器中を水素ガスで置換した後に、室温にて18時間攪拌した。反応終了後、水酸化パラジウム炭素をろ別し、ろ液に3M塩酸を加えて分液した。水層を5 M 水酸化ナトリウム水溶液で塩基性にし、塩化メチレンで抽出した。得られた有機層を減圧下にて濃縮して、目的物 4.27 gを褐色液体として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.56 (d, $J = 8.3$ Hz, 2H), 7.31 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H), 2.72 (s, 2H), 1.2-1.5 (m, 2H), 1.32 (s, 6H)

工程 3 ;

tert-butyl 2-(2-methyl-1-(4-(trifluoromethyl)phenyl)propan-2-yl)hydrazinecarboxylateの合成

2-methyl-1-(4-(trifluoromethyl)phenyl)propan-2-amine 4.2 gを塩化メチレン 30 mLに溶解し、氷冷下にて、別途調整したt-butyl 3-(trichloromethyl)-1,2-oxaziridine-2-carboxylate 5.6 g (21 mmol)を添加した。室温にて30分攪拌した後、反応溶液を10%クエン酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水にて順次洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥 減圧下塩化メチレンを除去した。得られた残渣を中圧シリカゲルカラムクロマトグラフィー（シリカゲル100 g、酢酸エチル :ヘキサン）にて精製し、目的物1.38 gを白色固体として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.54 (d, $J = 8.3$ Hz, 2H), 7.30 (d, $J = 8.2$ Hz, 2H), 5.8–6.0 (m, 1H), 2.74 (s, 2H), 1.46 (s, 9H), 1.4–1.5 (m, 1H), 1.03 (s, 6H)

[0200] 合成例 1 5

tert-butyl 2-(1-benzylcyclopropyl)hydrazinecarboxylateの合成

工程 1 ;

1-benzylcyclopropanamineの合成

フェニルアセトニトリル 4.5 g(38 mmol)をテトラヒドロフラン 50 mLに溶解し、オルトチタン酸テトライソプロピル12.4 mL(41.9 mmol)、エチルマグネシウムブロミドの0.98Mテトラヒドロフラン溶液 78 mL(76 mmol)を順次添加し、室温にて1時間攪拌した。攪拌終了後、三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体 9.6 mL(78 mmol)を添加し、さらに室温にて1時間攪拌を継続した。反応終了後、2M 水酸化ナトリウム水溶液を添加し、ジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層に3M塩酸を添加し、分液した。得られた水層を5M 水酸化ナトリウム水溶液で塩基性にし、塩化メチレンで抽出した。得られた有機層を減圧下にて溶媒を留去することにより、目的物3.28 gを得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.2–7.4 (m, 5H), 2.75 (s, 2H), 1.4–1.6 (

m, 2H), 0.6-0.7 (m, 4H)

工程 2 ;

tert-butyl 2-(1-benzylcyclopropyl)hydrazinecarboxylateの合成

1-benzylcyclopropanamine 10.6 g(72.0 mmol)を塩化メチレン 90 mLに溶解し、氷冷下にて、別途調製したt-butyl 3-(trichloromethyl)-1,2-oxaziridine-2-carboxylate 14.3 g(54.5 mmol)を添加し、室温にて30分攪拌した。反応終了後、減圧下にて塩化メチレンを留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (シリカゲル350 g、酢酸エチル : ヘキサン = 1: 20)にて精製し、目的物 4.6 gを褐色固体として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.2-7.4 (m, 5H), 5.8-6.0 (m, 1H), 3.9-4.2 (m, 1H), 2.87 (s, 2H), 1.45 (s, 9H), 0.75-0.85 (m, 2H), 0.5-0.55 (m, 2H)

[0201] 合成例 1 6

tert-butyl 2-(3-benzylpentan-3-yl)hydrazinecarboxylateの合成

工程 1

3-benzylpentan-3-amineの合成

フェニルアセトニトリル 3.0 g(26 mmol)をテトラヒドロフラン 50 mLに溶解し、チタンイソプロポキシド 8.3mL(28 mmol)を添加し、窒素雰囲気下、エチルマグネシウムブロミドの0.90Mテトラヒドロフラン 溶液 115 mL(104 mmol)を滴下した。1時間攪拌した後、氷冷下にて水を滴下し、反応を停止させた。反応混合物を酢酸エチルで希釈し、分液した。得られた有機層に1M塩酸を添加し、分液した。得られた水層を5M 水酸化ナトリウム水溶液で塩基性にし、塩化メチレンで抽出した。得られた塩化メチレン層を、減圧下にて濃縮して、目的物(粗収量2.68 g)を得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.1-7.5 (m, 5H), 2.64 (s, 2H), 1.2-1.5 (m, 6H), 0.91 (t, $J = 7.5$ Hz, 6H)

工程 2 ;

tert-butyl 2-(3-benzylpentan-3-yl)hydrazinecarboxylateの合成

3-benzylpentan-3-amine 2.68 gを塩化メチレン 20 mLに溶解し、氷冷下にて、別途調製したt-butyl 3-(trichloromethyl)-1,2-oxaziridine-2-carboxylate 4.8 g(18 mmol)を添加した。室温にて30分攪拌した後、反応溶液を10%クエン酸水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水にて順次洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥 減圧下塩化メチレンを除去した。得られた残渣を中圧シリカゲルカラムクロマトグラフィー（シリカゲル30 g、酢酸エチル：ヘキサン＝0：100～20：80）にて精製し、目的物 1.62 gを薄褐色固体として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 7.1-7.4 (m, 5H), 5.5-5.7 (br, 1H), 3.6-3.8 (Br, 1H), 2.66 (s, 2H), 1.55 (s, 9H), 1.3-1.5 (m, 4H), 0.93 (t, J = 7.5 Hz, 6H)

[0202] 合成例 17

ethyl 2-(furan-2-yl)-4-methyl-3-oxopentanoateの合成

工程 1 ;

2-(furan-2-yl)acetic acidの合成

フルフリルアルコール 25 g(0.25 mmol)をテトラヒドロフラン 250 mLに溶解し、氷冷下にて三臭化リン 8.7 mLを添加し、同温度にて90分攪拌した。反応終了後、ジエチルエーテルを添加し、蒸留水にて洗浄した後、得られた有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水の順に洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮し、2-(bromomethyl)furanの粗物を得た

2-(bromomethyl)furanをN,N-ジメチルホルムアミド 125 mLに溶解し、シアニ化ナトリウム 13.7 g(0.280mmol)を添加し、室温にて11時間攪拌した。攪拌終了後、N,N-ジメチルホルムアミド 100 mL、シアニ化ナトリウム 13.7 g(0.280 mmol)を添加し、更に8時間攪拌を継続した。反応終了後、ジエチルエーテルを添加し、蒸留水にて洗浄した後、得られた有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮し、。2-(furan-2-yl)acetonitrileの粗物を得た。

2-(furan-2-yl)acetonitrileを蒸留水 300 mLに懸濁させ、水酸化カリウム 50 g (0.89 mmol)を添加し、4時間加熱還流した。反応終了後、ジエチルエーテルを添加して分液した後、得られた水層を濃塩酸で酸性にし、酢酸エチルを加えて抽出した。得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮して目的物 25.2 gを得た。

工程 2 ;

ethyl 2-(furan-2-yl)acetateの合成

2-(furan-2-yl)acetic acid 24.8 gをN,N-ジメチルホルムアミド 590 mLに溶解し、炭酸カリウム32.6 g(0.236 mol)、炭酸セシウム 6.42 g(19.7 mmol)の順に添加した。さらに氷冷下にて、ヨードエタン 19 mL(0.24mol)を添加し、室温にて14時間攪拌した。反応終了後、反応混合物に蒸留水を添加した後、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮して、目的物 17.0 gを褐色液体として得た。

工程 3 ;

ethyl 2-(furan-2-yl)-4-methyl-3-oxopentanoateの合成

窒素雰囲気下、テトラヒドロフラン 60 mL及びジイソプロピルアミン 9.3 mL(66 mmol)に、氷冷下にて1.57 M n-ブチルリチウム/n-ヘキサン溶液38 mL(60 mmol)を滴下し、室温まで昇温した後に、30分攪拌した。攪拌終了後、-78°Cに冷却し、ethyl 2-(furan-2-yl)acetate 4.62 g(30.0 mmol)を滴下し、同温度にて1時間攪拌した。攪拌終了後、-78°Cにてイソブチリルクロリド3.8 mL(36 mmol)を添加し、徐々に昇温した後に、室温にて15時間攪拌した。反応終了後、氷冷下にて反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を添加し、酢酸エチルにて抽出した。得られた有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水の順に洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥、ろ過、減圧下にて濃縮した。得られた残渣を中圧シリカゲルカラムクロマトグラフィー（シリカゲル30 g、酢酸エチル : ヘキサン=1 : 10）にて精製し、目的物 22gを橙色液体として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 13.5 (s, 1H), 7.4–7.5 (m, 1H), 6.35–6.45 (m, 1H), 6.1–6.2 (m, 1H), 4.19 (q, $J = 7.1$ Hz, 2H), 2.4–2.6 (m, 1H), 1.22 (t, $J = 7.1$ Hz, 3H), 1.11 (d, $J = 6.9$ Hz, 6H)

[0203] 合成例 18

O-hexylhydroxylamineの合成

工程 1

2-(hexyloxy)isoindoline-1,3-dioneの合成

N-ヒドロキシスクシイミド 3.0 g (18 mmol) を N,N-ジメチルホルムアミド 30 mL に溶解し、氷冷下にて 60 重量% 水素化ナトリウム（鉱油中に分散）0.81 g (20 mmol) を添加し、室温にて 30 分攪拌した。攪拌終了後、氷冷下にて ブロモヘキサン 2.8 mL (20 mmol)、ヨウ化ナトリウム 35 mg (0.23 mmol) を順次滴下し、70°C にて 20 時間攪拌を継続した。反応終了後、反応混合物を氷水に投入し、反応混合物中に析出した固体をろ過により取り出し、乾燥することにより、目的物 5.82 g を白色固体として得た。

工程 2 ;

O-hexylhydroxylamineの合成

2-(hexyloxy)isoindoline-1,3-dione 5.82 g をメタノール 95 mL に溶解させ、ヒドラジン・一水和物 3.0 mL (62 mmol) を添加し、65°C にて 30 分攪拌した。反応終了後、反応混合物中に析出した固体をろ過により取り出し、得られた固体を塩化メチレンで洗浄した。塩化メチレン溶液とろ液を併せ、減圧下にて濃縮し、単蒸留（塔頂 110°C）することで、目的物とヒドラジンの混合物を得た。得られた混合物にジエチルエーテルを添加し、蒸留水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥、ろ過、減圧下濃縮することで、目的物 0.76 g を無色液体として得た。

^1H NMR (CDCl_3 , Me_4Si , 300MHz) δ 5.84 (s, 2H), 3.49 (t, $J = 6.6$ Hz, 3H), 1.4–1.6 (m, 2H), 1.2–1.4 (m, 6H), 0.86 (t, $J = 6.6$ Hz, 3H)

[0204] 上記以外の本発明化合物は、前記製造法及び実施例に準じて製造することができる。合成例 1 及び 2 と同様に製造した本発明化合物の構造を、前記実

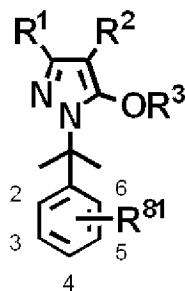
施例に記載された化合物と共に第 16 表乃至第 20 表に示すが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

尚、表中Etとの記載はエチル基を表し、以下同様にn-Pr及びPr-nはノルマルプロピル基を、i-Pr及びPr-iはイソプロピル基を、c-Pr及びPr-cはシクロプロピル基を、n-Bu及びBu-nはノルマルブチル基を、s-Bu及びBu-sはセカンダリーブチル基を、i-Bu及びBu-iはイソブチル基を、t-Bu及びBu-tはt-ブチル基を、c-Bu及びBu-cはシクロブチル基を、n-Pen及びPen-nはノルマルペンチル基を、c-Pen及びPen-cはシクロペンチル基を、n-Hex及びHex-nはノルマルヘキシル基を、c-Hex及びHex-cはシクロヘキシル基を、Phはフェニル基をそれぞれ表す。

表 16、表 17、表 18、表 19 及び表 20 中の「No.」は、本発明化合物のNo.である。

第 16 表

[0205] [化51]



[0206] -----

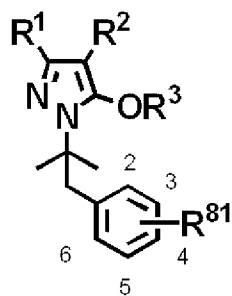
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁸¹
1-01	CH ₃	H	H	H
1-02	CH ₃	CH ₃	H	H
1-03	CH ₃	n-Hex	H	H
1-04	CH ₃	PhCH ₂	H	H
1-06	Ph	Ph	H	H
1-07	n-Pr	Ph	H	H

1-11	CH ₃	Ph	H	H
3-01	4-(OCH ₃)Ph	H	H	H
3-02	i-Pr	H	H	H
3-03	Ph	H	H	H
3-04	1,1-(CH ₃) ₂ -2-Ph-Et	H	H	H
3-08	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	H
3-13	Ph	H	CH ₃	H
3-14	Ph	CH ₃	CH ₃	H
3-27	c-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	H
3-28	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	4-Cl
3-29	c-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	4-Cl
3-30	(4-Ph)Ph	(4-n-Hex)Ph	H	4-Cl
3-31	(4-Ph)Ph	n-Hex	H	4-Cl
3-32	(4-t-Bu)Ph	(4-n-Hex)Ph	H	4-Cl
4-01	CH ₂ C(O)OCH ₃	H	H	H
4-12	i-Pr	n-Pr	H	H
4-13	(4-Ph)Ph	(4-n-Hex)Ph	H	H
4-14	(4-Ph)Ph	n-Hex	H	H
4-15	(4-t-Bu)Ph	(4-n-Hex)Ph	H	H
4-16	(4-t-Bu)Ph	n-Hex	H	H
4-17	(4-t-Bu)Ph	n-Hex	H	4-Cl
4-27	i-Pr	C(O)OEt	H	H

第 17 表

[0207]

[化52]



[0208] -----

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁸¹
1-12	CH ₃	Ph	H	H
2-01	CH ₃	H	H	H
2-02	CH ₃	CH ₃	H	H
2-03	CH ₃	n-Hex	H	H
2-04	CH ₃	PhCH ₂	H	H
2-05	CF ₃	Ph	H	H
2-06	Ph	Ph	H	H
2-07	n-Pr	Ph	H	H
2-09	i-Pr	Ph	H	H
2-10	c-Pr	Ph	H	H
2-12	n-Bu	Ph	H	H
2-14	(4-CH ₃)Ph	Ph	H	H
2-15	(4-Cl)Ph	Ph	H	H
2-16	(3,4-(OCH ₃) ₂)Ph	Ph	H	H
2-18	pyridin-2-yl	Ph	H	H
2-19	CH ₃	(4-CH ₃)Ph	H	H
2-20	CH ₃	(2-CH ₃)Ph	H	H
2-21	CH ₃	{3,4-(CH ₃) ₂ }Ph	H	H
2-22	CH ₃	(4-Ph)Ph	H	H

2-23	CH ₃	(4-t-Bu)Ph	H	H
2-24	CH ₃	naphthalen-1-yl	H	H
2-25	CH ₃	(4-n-Hex)Ph	H	H
2-28	CH ₃	(4-OCH ₃)Ph	H	H
2-29	CH ₃	benzo[d][1,3]dioxol-5-yl	H	H
2-30	CH ₃	{4-O(CH ₂) ₂ OEt}Ph	H	H
2-31	CH ₃	(4-Cl)Ph	H	H
2-32	CH ₃	(3,4-Cl ₂)Ph	H	H
2-33	CH ₃	thiophen-2-yl	H	H
2-34	i-Pr	(4-CH ₃)Ph	H	H
2-35	i-Pr	(2-CH ₃)Ph	H	H
2-36	i-Pr	{3,4-(CH ₃) ₂ }Ph	H	H
2-37	i-Pr	(4-Ph)Ph	H	H
2-38	i-Pr	(4-t-Bu)Ph	H	H
2-39	i-Pr	naphthalen-1-yl	H	H
2-40	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	H
2-43	i-Pr	(4-OCH ₃)Ph	H	H
2-44	i-Pr	benzo[d][1,3]dioxol-5-yl	H	H
2-45	i-Pr	{4-O(CH ₂) ₂ OEt}Ph	H	H
2-46	i-Pr	(4-Cl)Ph	H	H
2-47	i-Pr	(3,4-Cl ₂)Ph	H	H
2-48	i-Pr	thiophen-2-yl	H	H
2-49	CH ₃	(4-CF ₃)Ph	H	H
2-50	i-Pr	(4-CF ₃)Ph	H	H
3-05	i-Pr	H	H	4-CH ₃
3-06	(4-OCH ₃)Ph	H	H	4-CH ₃
3-07	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	4-CH ₃

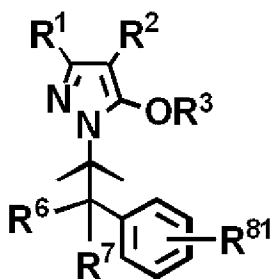
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁸¹
3-09	CF ₃	H	H	4-CH ₃
3-10	1,1-(CH ₃) ₂ -2-Ph-Et	H	H	4-CH ₃
3-11	Ph	H	H	4-CH ₃
3-12	i-Pr	H	H	4-Br
3-16	Ph	H	H	H
3-17	i-Pr	H	H	H
3-18	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	2-CH ₃
3-19	i-Pr	H	H	3-CH ₃
3-20	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	3-CH ₃
3-21	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	PhC(0)	3-CH ₃
3-22	i-Pr	H	H	4-t-Bu
3-23	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	PhC(0)	4-t-Bu
3-33	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	4-Cl
3-34	c-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	4-Cl
3-35	i-Pr	n-Pr	H	4-Cl
3-36	(4-Ph)Ph	(4-n-Hex)Ph	H	4-Cl
3-37	(4-t-Bu)Ph	(4-n-Hex)Ph	H	4-Cl
3-38	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	4-OCH ₃
3-39	c-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	4-OCH ₃
3-40	(4-Ph)Ph	(4-n-Hex)Ph	H	4-OCH ₃
3-41	(4-t-Bu)Ph	(4-n-Hex)Ph	H	4-OCH ₃
3-43	i-Pr	H	PhC(0)	4-t-Bu
3-44	i-Pr	n-Pr	H	H
3-45	(4-t-Bu)Ph	n-Hex	H	H
3-46	i-Pr	Br	H	3-CH ₃

3-47	i-Pr	Br	H	H
3-48	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	4-n-Hex
3-49	i-Pr	H	PhC(O)	H
4-03	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	CH ₃	4-n-Hex
4-18	(4-Ph)Ph	n-Hex	H	4-Cl
4-19	(4-t-Bu)Ph	n-Hex	H	4-Cl
4-20	(4-Ph)Ph	n-Hex	H	4-OCH ₃
4-21	(4-t-Bu)Ph	n-Hex	H	4-OCH ₃
4-22	i-Pr	n-Pr	H	4-OCH ₃
4-23	i-Pr	(4-C(O)OMe)Ph	CH ₃	H
4-56	i-Pr	(4-n-C ₈ H ₁₇)Ph	H	4-CH ₃
4-57	i-Pr	(4-c-Hex)Ph	H	4-CH ₃
4-58	i-Pr	furan-2-yl	H	4-CH ₃
4-59	n-Hex	(4-n-Hex)Ph	H	4-CH ₃
4-60	c-Hex	(4-n-Hex)Ph	H	4-CH ₃
4-61	furan-2-yl	(4-n-Hex)Ph	H	4-CH ₃
4-62	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	C(O)OEt
4-71	i-Pr	C(O)Ph	H	H
4-72	(2,4-F ₂)Ph	(4-n-Hex)Ph	H	4-CH ₃
4-73	C(O)OEt	(4-n-Hex)Ph	H	4-CH ₃
4-74	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	4-CF ₃
4-75	(2,4-F ₂)Ph	(4-n-Hex)Ph	H	4-CF ₃
4-76	C(O)OEt	(4-n-Hex)Ph	H	4-CF ₃
4-83	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	2,4-F ₂
4-84	(2,4-F ₂)Ph	(4-n-Hex)Ph	H	2,4-F ₂
4-85	C(O)OEt	(4-n-Hex)Ph	H	2,4-F ₂
4-86	CN	(4-n-Hex)Ph	H	4-CH ₃
4-88	i-Pr	C(O)CH ₃	H	H

4-89	i-Pr	C(NOCH ₃)CH ₃	H	H
4-90	H	(4-n-Hex)Ph	H	4-CH ₃
4-91	i-Pr	C(NO-n-Hex)CH ₃	H	H

第 18 表

[0210] [化53]

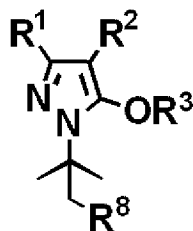


[0211]

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ⁸¹
3-24	i-Pr	H	H	CH ₃	H	H
3-25	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	CH ₃	H	H

第 19 表

[0212] [化54]



[0213]

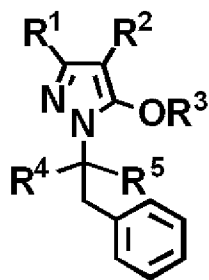
No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁸
4-28	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	naphthalen-1-yl
4-29	i-Pr	(4-n-C ₈ H ₁₇)Ph	H	naphthalen-1-yl

4-30	i-Pr	(4-c-Hex)Ph	H	naphthalen-1-yl
4-31	i-Pr	furan-2-yl	H	naphthalen-1-yl
4-32	n-Hex	(4-n-Hex)Ph	H	naphthalen-1-yl
4-33	c-Hex	(4-n-Hex)Ph	H	naphthalen-1-yl
4-34	furan-2-yl	(4-n-Hex)Ph	H	naphthalen-1-yl
4-35	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	thiophen-2-yl
4-36	i-Pr	(4-n-C ₈ H ₁₇)Ph	H	thiophen-2-yl
4-37	i-Pr	(4-c-Hex)Ph	H	thiophen-2-yl
4-38	i-Pr	furan-2-yl	H	thiophen-2-yl
4-39	n-Hex	(4-n-Hex)Ph	H	thiophen-2-yl
4-40	c-Hex	(4-n-Hex)Ph	H	thiophen-2-yl
4-41	furan-2-yl	(4-n-Hex)Ph	H	thiophen-2-yl
4-42	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	1-adamantyl
4-43	i-Pr	(4-n-C ₈ H ₁₇)Ph	H	1-adamantyl
4-44	i-Pr	(4-c-Hex)Ph	H	1-adamantyl
4-45	i-Pr	furan-2-yl	H	1-adamantyl
4-46	n-Hex	(4-n-Hex)Ph	H	1-adamantyl
4-47	c-Hex	(4-n-Hex)Ph	H	1-adamantyl
4-48	furan-2-yl	(4-n-Hex)Ph	H	1-adamantyl
4-80	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	2,3-dihydro-1H-inden-5-yl
4-81	(2,4-F ₂)Ph	(4-n-Hex)Ph	H	2,3-dihydro-1H-inden-5-yl
4-82	C(=O)OEt	(4-n-Hex)Ph	H	2,3-dihydro-1H-inden-5-yl

第 20 表

[0214]

[化55]



[0215] -----

No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
4-49	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	-CH ₂ CH ₂ -	
4-50	i-Pr	(4-n-Oct)Ph	H	-CH ₂ CH ₂ -	
4-51	i-Pr	(4-c-Hex)Ph	H	-CH ₂ CH ₂ -	
4-52	i-Pr	furan-2-yl	H	-CH ₂ CH ₂ -	
4-53	n-Hex	(4-n-Hex)Ph	H	-CH ₂ CH ₂ -	
4-54	c-Hex	(4-n-Hex)Ph	H	-CH ₂ CH ₂ -	
4-55	furan-2-yl	(4-n-Hex)Ph	H	-CH ₂ CH ₂ -	
4-87	i-Pr	(4-n-Hex)Ph	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅

[0216] 次に第 16 表乃至第 20 表中の本発明化合物の物性値を第 21 表に示す。

物性値としてプロトン核磁気共鳴 (¹H NMR) ケミカルシフト値又は融点を記載する。

但し R³ が水素原子の場合、¹H NMR 測定時、化合物の構造が測定条件によって互変異性体構造 P-1, P-2 又は P-3 をとることが分かっている。第 21 表には物性値に加え ¹H NMR 測定条件、互変異性体の構造、互変異性体の混合物の場合その混合比、を記載する。

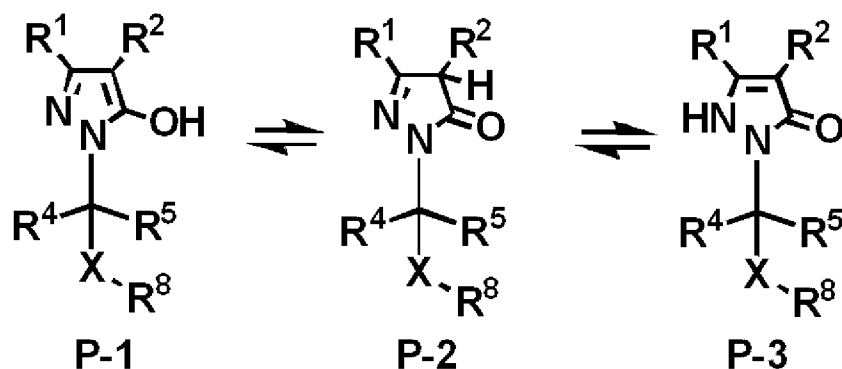
¹H NMR 測定は、基準物質としてテトラメチルシラン (Me₄Si) を用い、以下の (i) ~ (iii) の条件により行った。

(i) ; 測定溶媒 CDCl₃, 300MHz。

(i i) ; 測定溶媒DMSO-d₆, 300MHz。

(i i i) ; 測定溶媒DMSO-d₆, 400MHz。

[0217] [化56]



[0218] 第 2 1 表

No.	測定条件	互変異性体	混合比
¹ H NMRケミカルシフト値 又は融点			
1-01	(i)	P-2	
	δ 7.2-7.4 (m, 5H), 3.22 (s, 2H), 2.07 (s, 3H), 1.87 (s, 6H)		
1-02	(i)	P-2	
	δ 7.2-7.4 (m, 5H), 3.00 (q, J = 8.0 Hz, 1H), 2.03 (s, 3H), 1.91 (s, 6H), 1.30 (d, J = 7.7 Hz, 3H)		
1-03	(i i)	P-1とP-3の混合物	6 : 4
	δ 9.33 (s, 1H), 6.8-7.5 (m, 5H), 2.1-2.3(m, 2H), 2.03 (s, 3H), 1.80 (s, 6H) , 1.1-1.4(m, 8H), 0.8-0.9(m, 3H)		
	δ 9.4-9.5 (br, 1H), 6.8-7.5 (m, 5H), 2.1-2.3(m, 2H), 2.03 (s, 3H), 1.74(s, 6H), 1.1-1.4(m, 8H), 0.8-0.9(m, 3H)		
1-04	(i)	P-2	
	δ 6.8-7.4 (m, 10H), 2.9-3.7 (m, 3H), 1.4-2.2(m, 9H)		
1-06	(i i)	P-1	
	δ 9.89 (s, 1H), 7.0-7.5 (m, 15H), 1.96 (s, 6H)		

1-07 (i i) P-1とP-3の混合物 7 : 3

δ 9.66 (s, 1H), 6.9-7.6 (m, 10H), 2.5-2.6 (m, 2H), 1.8-2.0 (m, 6H),
1.4-1.7 (m, 2H), 0.8-1.0 (m, 3H)

δ 10.27 (s, 1H), 6.9-7.6 (m, 10H), 2.6-2.7 (m, 2H), 1.8-2.0 (m, 6H),
1.4-1.7 (m, 2H), 0.8-1.0 (m, 3H)

1-11 融点 224~225°C

1-12 融点 188~189°C

2-01 (i) P-2

δ 7.1-7.3 (m, 5H), 3.17(s, 2H), 3.11(s, 2H), 2.01 (s, 3H), 1.50 (s,
6H)

2-02 (i) P-2

δ 7.0-7.3 (m, 5H), 2.8-3.3 (m, 3H) , 1.2-2.1 (m, 12H)

2-03 (i) P-2

δ 7.0-7.3 (m, 5H), 3.19(d, J = 13.2 H z , 1H), 3.06(d, J = 13.2 H
z , 1H), 2.97(t, J = 5.7 H z , 1H) , 1.98 (s, 3H), 1.49 (s, 6H), 0.
8-1.4 (m, 13H)

2-04 (i i i) P-1とP-3の混合物 5 : 5

δ 10.04 (s, 1H), 7.0-7.4 (m, 8H), 6.8-6.9 (m, 2H), 3.67(s, 2H), 3.15
(s, 2H), 1.77(s, 3H), 1.48(s, 6H)

δ 9.43 (s, 1H), 7.0-7.4 (m, 8H), 6.8-6.9 (m, 2H), 3.46(s, 2H), 3.21(
s, 2H), 1.90(s, 3H), , 1.40(s, 6H)

2-05 (i i) P-1

δ 10.96 (s, 1H), 7.3-7.6 (m, 5H), 7.1-7.3 (m, 3H), 6.9-7.0 (m, 2H),
3.23 (s, 2H), 1.59 (s, 6H)

2-06 (i i) P-1

δ 10.14 (s, 1H), 7.1-7.5 (m, 13H), 6.9-7.1 (m, 2H), 3.24 (s, 2H), 1
.61 (s, 6H)

2-07 (i i) P-1とP-3の混合物 5 : 5

δ 9.89(s, 1H), 6.8-7.6 (m, 10H), 3.26(s, 2H), 2.3-2.5 (m, 2H), 1.52(s, 6H), 1.3-1.5 (m, 2H), 0.7-0.9 (m, 3H)

δ 9.84 (s, 1H), 6.8-7.6 (m, 10H), 3.17(s, 2H), 2.3-2.5 (m, 2H), 1.49(s, 6H), 1.3-1.5 (m, 2H), 0.7-0.9 (m, 3H)

[0219] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
¹ H NMRケミカルシフト値 又は融点			
2-09	(i i)	P-1とP-3の混合物	7 : 3
δ 9.79(s, 1H), 7.3-7.5 (m, 4H), 7.1-7.3(m, 4H), 6.8-6.9(m, 2H), 3.14 (s, 2H), 2.87(sep, J = 6.9 H z , 1H) , 1.53(s, 6H), 1.02(d, J = 6.8 H z , 6H)			
δ 9.39 (s, 1H), 7.3-7.5 (m, 4H), 7.1-7.3(m, 4H), 7.0-7.1(m, 2H), 3.20(s, 2H), 2.8-3.1 (m, 1H), 1.53(s, 6H), 1.06(d, J = 7.1 H z , 6H)			
2-10	(i i)	P-1とP-3の混合物	7 : 3
δ 9.95(s, 1H), 7.51(d, J = 6.9 H z , 2H) , 7.3-7.5 (m, 3H), 7.1-7.3 (m, 3H), 6.8-6.9(m, 2H), 3.14 (s, 2H), 1.6-1.8 (m, 1H), 1.49(s, 6H), 0.6-0.7 (m, 4H)			
δ 9.19 (s, 1H), 7.75(d, J = 7.4 H z , 2H) , 7.3-7.5 (m, 3H), 7.1-7.3(m, 3H), 7.0-7.1(m, 2H), 3.21(s, 2H), 1.8-2.0 (m, 1H), 1.46(s, 6H) 0.8-0.9 (m, 4H)			
2-12	(i i)	P-1とP-3の混合物	5 : 5
δ 9.90(s, 1H), 6.8-7.6(m, 10H) , 3.25(s, 2H), 2.42(t, J = 7.6 H z , 2H) , 1.52(s, 6H), , 1.1-1.5 (m, 4H), 0.7-0.9 (m, 3H)			
δ 9.84 (s, 1H), 6.8-7.6(m, 10H) , 3.17 (s, 2H), 2.42(t, J = 7.6 H z , 2H) , 1.49(s, 6H) , 1.1-1.5 (m, 4H), 0.7-0.9 (m, 3H)			
2-14	(i i)	P-1	

δ 9.9–10.2 (br, 1H), 6.9–7.4 (m, 14H), 3.24 (s, 2H), 2.24 (s, 3H), 1.59 (s, 6H)

2-15 (i i) P-1

δ 10.25(s, 1H), 7.1–7.5 (m, 12H), 6.9–7.1 (m, 2H), 3.24 (s, 2H), 1.60 (s, 6H)

2-16 (i i) P-1

δ 10.11(s, 1H), 6.6–7.4 (m, 13H), 3.71 (s, 3H), 3.48 (s, 3H), 3.24 (s, 2H), 1.59 (s, 6H)

2-18 (i i) P-1

δ 10.22 (s, 1H), 8.36(d, $J = 4.7$ Hz, 1H), 7.69(t, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.42(d, $J = 8.0$ Hz, 1H), 7.1–7.4 (m, 9H), 6.99(d, $J = 7.7$ Hz, 2H), 3.27 (s, 2H), 1.61 (s, 6H)

2-19 (i i) P-1とP-3の混合物 5 : 5

δ 9.97 (s, 1H), 6.9–7.6 (m, 9H), 3.19 (s, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.46 (s, 6H)

δ 9.89 (s, 1H), 6.9–7.6 (m, 9H), 3.28 (s, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 1.46 (s, 6H)

2-20 (i i) P-1とP-3の混合物 6 : 4

δ 9.97 (s, 1H), 7.1–7.3 (m, 7H), 6.9–7.0 (m, 2H), 3.0–3.4(m, 2H), 2.19(s, 3H),, 1.79(s, 3H), 1.51(s, 6H)

δ 9.83 (s, 1H), 7.1–7.3 (m, 7H), 6.9–7.0 (m, 2H), 3.0–3.4(m, 2H), 2.26(s, 3H), 1.89(s, 3H), 1.45(s, 6H)

2-21 (i i) P-1とP-3の混合物 5 : 5

δ 9.84(s, 1H), 7.41(s, 1H), 7.0–7.3 (m, 6H), 6.95(d, $J = 7.1$ Hz, 2H), 3.28(s, 2H), 2.24(s, 3H), 2.22(s, 3H), 2.15 (s, 3H), 1.44 (s, 6H)

δ 9.94(s, 1H), 7.41(s, 1H), 7.0–7.3 (m, 6H), 6.95(d, $J = 7.1$ Hz, 2H), 3.18(s, 2H), 2.24(s, 3H), 2.22(s, 3H), 2.03(s, 3H), 1.50 (s, 6H)

),

[0220] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
¹ H NMRケミカルシフト値 又は融点			
2-22	(i i)	P-1とP-3の混合物	6 : 4
δ 10.08(s, 1H), 6.9-7.8(m, 14H), 3.31(s, 2H), 2.24(s, 3H), 1.48 (s, 6H)			
δ 10.15 (s, 1H), 6.9-7.8(m, 14H), 3.21(s, 2H), 2.11 (s, 3H), 1.53 (s, 6H)			
2-23	(i i)	P-1とP-3の混合物	6 : 4
δ 9.88(s, 1H), 6.9-7.6(m, 9H), 3.28(s, 2H), 2.16(s, 3H), 1.45 (s, 6H), 1.30 (s, 18H)			
δ 9.97(s, 1H), 6.9-7.6(m, 9H), 3.18(s, 2H), 2.05 (s, 3H), 1.50 (s, 6H), 1.30 (s, 18H)			
2-24	(i i)	P-1とP-3の混合物	7 : 3
δ 10.00 (s, 1H), 6.9-8.0(m, 12H) , 3.29(d , J =14.0 H z , 1H) , 3.13(d , J =12.7 H z , 1H) , 1.77 (s, 3H), 1.58 (s, 6H)			
δ 10.06 (s, 1H), 6.9-8.0(m, 12H) , 3.1-3.4(m , 2H) , 1.90 (s, 3H), 1.52 (s, 6H)			
2-25	(i i)	P-1とP-3の混合物	6 : 4
δ 9.88(s, 1H), 6.9-7.7(m, 9H) , 3.29(s, 2H), 3.57(t, J =7.5 H z , 2H) , 2.16(s, 3H), 1.4-1.7 (m, 8H), 1.30 (s, 6H), 0.8-1.0 (m, 3H)			
δ 9.96 (s, 1H), 6.9-7.7(m, 9H) , 3.18(s, 2H), 3.57(t, J =7.5 H z , 2H) , 2.04(s, 3H), 1.4-1.7 (m, 8H), 1.30 (s, 6H), 0.8-1.0 (m, 3H)			
2-28	(i i)	P-1とP-3の混合物	5 : 5
δ 9.90 (s, 1H), 6.9-7.6 (m, 9H), 3.76 (s, 3H), 3.19 (s, 2H), 2.03 (s			

, 3H), 1.45 (s, 6H)

δ 9.80 (s, 1H), 6.9–7.6 (m, 9H), 3.76 (s, 3H), 3.28 (s, 2H), 2.13 (s, 3H), 1.45 (s, 6H)

2-29 (i i) P-1とP-3の混合物 5 : 5

δ 9.94 (s, 1H), 6.8–7.4(m, 8H), 6.00(s, 2H), 3.27(s, 2H), 2.15(s, 3H), 2.04(s, 3H), 1.44 (s, 6H)

δ 9.89(s, 1H), 6.8–7.4(m, 8H), 6.01(s, 2H), 3.17(s, 2H), 2.02(s, 3H), 2.04(s, 3H), 1.49 (s, 6H)

2-30 (i i) P-1とP-3の混合物 6 : 4

δ 9.80 (s, 1H), 7.52(d, J = 8.5 Hz, 2H) 7.1–7.4(m, 5H), 6.9–7.1(m, 2H), 4.0–4.2 (m, 2H), 3.6–3.8 (m, 2H), 3.51(q, J = 7.0 Hz, 2H), 3.29(s, 2H), 2.14(s, 3H), 1.44(s, 6H), 1.14(t, J = 7.0 Hz, 6H)

δ 9.90(s, 1H), 7.52(d, J = 8.5 Hz, 2H) 7.1–7.4(m, 5H), 6.9–7.1(m, 2H), 4.0–4.2 (m, 2H), 3.6–3.8 (m, 2H), 3.51(q, J = 7.0 Hz, 2H), 3.19(s, 2H), 2.02(s, 3H), 1.50(s, 6H), 1.14(t, J = 7.0 Hz, 3H)

2-31 (i i) P-1とP-3の混合物 7 : 3

δ 10.16(s, 1H), 6.9–7.8 (m, 9H), 3.29 (s, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.46 (s, 6H)

δ 10.16(s, 1H), 6.9–7.8 (m, 9H), 3.18 (s, 2H), 2.06 (s, 3H), 1.51 (s, 6H)

2-32 (i i) P-1とP-3の混合物 7 : 3

δ 10.4–10.5 (m, 1H), 6.8–8.2 (m, 8H), 3.1–3.4 (m, 2H), 2.1–2.4 (m, 3H), 1.48 (s, 6H)

δ 10.3–10.4 (m, 1H), 6.8–8.2 (m, 8H), 3.1–3.4 (m, 2H), 2.0–2.2 (m, 3H), 1.48 (s, 6H)

[0221] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
-----	------	-------	-----

¹H NMRケミカルシフト値 又は融点

2-33	(i i)	P-1とP-3の混合物	8 : 2
δ 10.3 (s, 1H), 6.9-7.5 (m, 8H), 3.28 (s, 2H), 2.26 (s, 3H), 1.45 (s, 6H)			
δ 10.2 (s, 1H), 6.9-7.5 (m, 8H), 3.18 (s, 2H), 2.12 (s, 3H), 1.50 (s, 6H)			
2-34	(i i)	P-1とP-3の混合物	8 : 2
δ 9.73 (s, 1H), 7.1-7.4 (m, 7H), 6.8-6.9 (m, 2H), 3.13 (s, 2H), 2.84 (sep, J = 7.1 Hz, 1H), 2.31 (s, 3H), 1.52 (s, 6H), 1.01 (d, J = 6.9 Hz, 6H)			
δ 9.31 (s, 1H), 7.1-7.4 (m, 7H), 7.0-7.1 (m, 2H), 3.20 (s, 2H), 2.9-3.1 (m, 1H), 2.31 (s, 3H), 1.52 (s, 6H), 1.05 (d, J = 6.9 Hz, 6H)			
2-35	(i i)	P-1とP-3の混合物	8 : 2
δ 9.76 (s, 1H), 7.1-7.3 (m, 7H), 6.8-6.9 (m, 2H), 3.21 (d, J = 12.7 Hz, 1H), 3.06 (d, J = 13.2 Hz, 1H), 2.4-2.6 (m, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.51 (s, 6H), 0.95 (d, J = 6.9 Hz, 3H)			
δ 9.41 (s, 1H), 7.1-7.3 (m, 7H), 7.0-7.1 (m, 2H), 3.1-3.4 (m, 2H), 2.4-2.6 (m, 1H), 2.22 (s, 3H), 1.55 (s, 6H), 0.86 (d, J = 6.9 Hz, 3H)			
2-36	(i i)	P-1とP-3の混合物	7 : 3
δ 9.70 (s, 1H), 6.8-7.3 (m, 8H), 3.14 (s, 2H), 2.85 (sep, J = 7.7 Hz, 1H), 2.23 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.52 (s, 6H), 1.01 (d, J = 6.9 Hz, 6H)			
δ 9.28 (s, 1H), 6.8-7.3 (m, 8H), 3.20 (s, 2H), 2.9-3.1 (m, 1H), 2.24 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.51 (s, 6H), 1.05 (d, J = 7.1 Hz, 6H)			
2-37	(i i)	P-1とP-3の混合物	7 : 3
δ 9.91 (s, 1H), 6.8-7.8 (m, 14H), 3.16 (s, 2H), 2.93 (sep, J = 6.9 Hz, 1H), 1.54 (s, 6H), 1.06 (d, J = 6.9 Hz, 6H)			

δ 9.48 (s, 1H), 6.8–7.8 (m, 14H), 3.22 (s, 2H), 3.0–3.1 (m, 1H), 1.54 (s, 6H), 1.10 (d, J = 7.1 Hz, 6H)

2-38 (i i) P-1とP-3の混合物 8 : 2

δ 9.7–9.8 (m, 1H), 7.1–7.5 (m, 7H), 6.8–6.9 (m, 2H), 3.13 (s, 2H), 2.8–2.9 (m, 1H), 1.52 (s, 6H), 1.31 (s, 9H), 1.03 (d, J = 6.6 Hz, 6H)

δ 9.3–9.4 (m, 1H), 7.1–7.5 (m, 7H), 7.0–7.1 (m, 2H), 3.2–3.3 (m, 2H), 2.9–3.1 (m, 1H), 1.52 (s, 6H), 1.31 (s, 9H), 1.03 (d, J = 6.6 Hz, 6H)

2-39 (i i) P-1とP-3の混合物 8 : 2

δ 9.76 (s, 1H), 7.2–8.1 (m, 10H), 6.9–7.0 (m, 2H), 3.1–3.3 (m, 2H), 2.4–2.8 (m, 1H), 1.60 (s, 6H), 0.87 (d, J = 6.9 Hz, 6H)

δ 9.6–9.7 (m, 1H), 7.2–8.1 (m, 10H), 7.14 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 3.1–3.3 (m, 2H), 2.4–2.8 (m, 1H), 1.55 (s, 6H), 0.96 (d, J = 6.6 Hz, 6H)

2-40 (i i) P-1とP-3の混合物 6 : 4

δ 9.72 (s, 1H), 7.1–7.4 (m, 7H), 6.8–6.9 (m, 2H), 3.14 (s, 2H), 2.85 (sep, J = 5.5 Hz, 1H), 2.57 (t, J = 6.7 Hz, 2H), 1.52 (s, 6H), 1.5–1.7 (m, 2H), 1.2–1.4 (m, 6H), 1.0–1.2 (m, 6H), 0.8–1.0 (m, 3H)

δ 9.3–9.4 (m, 1H), 7.1–7.4 (m, 7H), 7.0–7.1 (m, 2H), 3.19 (s, 2H), 2.9–3.1 (m, 1H), 2.57 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 1.52 (s, 6H), 1.5–1.7 (m, 2H), 1.2–1.4 (m, 6H), 1.0–1.2 (m, 6H), 0.8–1.0 (m, 3H)

[0222] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
^1H NMRケミカルシフト値 又は融点			

2-43 (i i) P-1とP-3の混合物 7 : 3

δ 9.68 (s, 1H), 6.8–7.4 (m, 9H), 3.77 (s, 3H), 3.13 (s, 2H), 2.82 (sep, J = 6.6 Hz, 1H), 1.52 (s, 6H), 1.01 (d, J = 6.8 Hz, 6H)

δ 9.27 (s, 1H), 6.8–7.4 (m, 9H), 3.77 (s, 3H), 3.20 (s, 2H), 2.9–3.1 (m, 1H), 1.52 (s, 6H), 1.05 (d, J = 7.0 Hz, 6H)

2-44 (i i) P-1とP-3の混合物 7 : 3

δ 9.73 (s, 1H), 6.7–7.5 (m, 8H), 6.02 (s 2H), 3.12 (s, 2H), 2.83(sep, J = 6.8 Hz, 1H), 1.51 (s, 6H), 1.01 (d, J = 6.8 Hz, 6H)

δ 9.33 (s, 1H), 6.7–7.5 (m, 8H), 6.02 (s 2H), 3.19 (s, 2H), 2.9–3.1 (m, 1H), 1.51 (s, 6H), 1.0–1.2 (m, 6H)

2-45 (i i) P-1とP-3の混合物 7 : 3

δ 9.68 (s, 1H), 6.8–7.4 (m, 9H), 4.0–4.2 (m, 2H), 3.6–3.8 (m, 2H), 3.51 (q, J = 6.9 Hz, 2H), 3.13 (s, 2H), 2.82(sep, J = 6.9 Hz, 1H), 1.52 (s, 6H), 1.14 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.00 (d, J = 6.9 Hz, 6H)

δ 9.27 (s, 1H), 6.8–7.4 (m, 9H), 4.0–4.2 (m, 2H), 3.6–3.8 (m, 2H), 3.51 (q, J = 6.9 Hz, 2H), 3.20 (s, 2H), 2.94 (sep, J = 8.8 Hz, 1H), 1.52 (s, 6H), 1.14 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.05 (d, J = 6.9 Hz, 6H)

2-46 (i i) P-1とP-3の混合物 7 : 3

δ 9.91 (s, 1H), 7.1–7.5 (m, 7H), 6.8–6.9 (m, 2H), 3.36 (s, 3H), 3.13 (s, 2H), 2.8–2.95 (m, 1H), 1.52 (s, 6H), 1.02(d, J = 6.9 Hz, 6H)

δ 9.55 (s, 1H), 7.1–7.5 (m, 7H), 7.0–7.1 (m, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.20 (s, 2H), 2.95–3.1 (m, 1H), 1.52 (s, 6H), 1.06(d, J = 6.9 Hz, 6H)

2-47 (i i) P-1

δ 10.0–10.2 (br, 1H), 7.4–7.8 (m, 2H), 7.1–7.4 (m, 4H), 6.8–7.1 (m, 2H), 3.15 (s, 2H), 2.8–3.1 (m, 1H), 1.53 (s, 6H), 1.05 (d, J = 6.6 Hz, 6H)

2-48 (i i) P-1とP-3の混合物 6 : 4

δ 10.05 (s, 1H), 6.8–7.5 (m, 8H), 3.14 (s, 2H), 2.8–3.1 (m, 1H), 1.51 (s, 6H), 1.08 (d, J = 6.6 Hz, 6H)

δ 9.61(s, 1H), 6.8–7.5 (m, 8H), 3.22 (s, 2H), 2.8–3.1 (m, 1H), 1.51 (s, 6H), 1.13 (d, J = 6.8 Hz, 6H)

2-49	(i i)	P-1とP-3の混合物	7 : 3
δ 10.41 (s, 1H), 6.9-8.1 (m, 9H), 3.29 (s, 2H), 2.24 (s, 3H), 1.49 (s, 6H)			
δ 10.3-10.4 (br, 1H), 6.9-8.1 (m, 9H), 3.1-3.4 (m, 2H), 2.12 (s, 3H), 1.49 (s, 6H)			
2-50	(i i)	P-1とP-3の混合物	8 : 2
δ 10.09 (s, 1H), 6.8-7.9 (m, 9H), 3.15 (s, 2H), 2.8-3.0 (m, 1H), 1.54 (s, 6H), 1.05 (s, 6H)			
δ 9.7-9.8 (br, 1H), 6.8-7.9 (m, 9H), 3.1-3.3 (m, 2H), 3.0-3.1 (m, 1H), 1.54 (s, 6H), 1.03 (s, 6H)			

[0223] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
^1H NMRケミカルシフト値 又は融点			
3-01	(i)	P-2	
δ 7.60 (dd, J = 6.8, 2.1Hz, 2H), 7.20-7.30 (m, 5H), 6.91 (dd, J = 6.8, 2.4Hz, 2H), 3.8 (s, 3H), 3.60 (s, 2H), 1.94 (s, 6H)			
3-02	(i)	P-2	
δ 7.15-7.35 (m, 5H), 3.20 (s, 2H), 2.68 (sep, J = 6.8Hz, 1H), 1.86 (s, 6H), 1.17 (d, J = 6.8Hz, 6H)			
3-03	(i)	P-2	
δ 7.62-7.70 (m, 2H), 7.20-7.45 (m, 8H), 3.63 (s, 2H), 1.95 (s, 6H)			
3-04	(i)	P-2	
δ 7.15-7.34 (m, 8H), 6.98-7.10 (m, 2H), 3.08 (s, 2H), 2.79 (s, 2H), 1.84 (s, 6H), 1.18 (s, 6H)			
3-05	(i)	P-2	
δ 7.04 (d, J = 8.0Hz, 2H), 6.98 (d, J = 8.0Hz, 2H), 3.13 (s, 2H), 3.0			

5 (s, 2H), 2.59 (sep, J = 6.8Hz, 1H), 2.30 (s, 3H), 1.50 (s, 6H), 1.09 (d, 6.8Hz, 6H)

3-06 (i) P-2

δ 7.55 (dd, J = 6.8, 2.1Hz, 2H), 7.03 (s, 4H), 6.91 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.14 (s, 2H), 3.56 (s, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.56 (s, 6H)

3-07 (i) P-2

δ 7.18~7.42 (m, 4H), 7.00 (s, 4H), 3.21 (s, 2H), 3.16 (sep, J = 7.2Hz, 1H), 2.61 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.62 (s, 6H), 1.54~1.58 (m, 2H), 1.26~1.36 (m, 6H), 1.07 (d, J=7.2Hz, 6H), 0.87~0.92 (m, 3H)

3-08 (i) P-2

δ 6.91~7.42 (m, 9H), 3.22 (sep, J = 7.2Hz, 1H), 2.4~2.7 (m, 2H), 1.55 (s, 6H), 1.53~1.57 (m, 2H), 1.23~1.35 (m, 6H), 1.12 (d, J=7.2Hz, 6H), 0.8~0.9 (m, 3H)

3-09

融点 144.6~145.5°C

3-10 (i) P-2

δ 6.91~7.33 (m, 9H), 3.06 (s, 2H), 3.05 (s, 2H), 2.73 (s, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.49 (s, 6H), 1.10 (s, 6H)

3-11 (i) P-2

δ 7.55~7.66 (m, 2H), 7.25~7.42 (m, 3H), 7.03 (s, 4H), 3.58 (s, 2H), 3.14 (s, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.58 (s, 6H)

3-12 (i) P-2

δ 7.35 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.98 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 3.14 (s, 2H), 3.06 (s, 2H), 2.59 (sep, J = 6.8 Hz, 1H), 1.50 (s, 6H), 1.10 (d, J = 7.1 Hz, 6H)

3-13 (i) P-1

δ 7.83 (d, $J = 7.4$ Hz, 2H), 7.38 (t, $J = 7.4$ Hz, 2H), 7.15–7.33 (m, 4 H), 7.08 (d, $J = 7.1$ Hz, 2H), 5.91 (s, 1H), 3.60 (s, 3H), 1.98 (s, 6H)

3-14 (i) P-1

δ 7.73 (d, $J = 7.4$ Hz, 2H), 7.41 (t, $J = 7.4$ Hz, 2H), 7.16–7.36 (m, 4 H), 3.16 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.98 (s, 6H)

3-16 (i) P-2

δ 7.12–7.62 (m, 10H), 3.59 (s, 2H), 3.19 (s, 2H), 1.59 (s, 6H)

[0224] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
^1H NMRケミカルシフト値 又は融点			
3-17	(i)	P-2	
δ 7.09–7.25 (m, 5H), 3.13 (s, 2H), 3.09 (s, 2H), 2.58 (sep, $J = 7.2$ Hz, 1H), 1.52 (s, 6H), 1.09 (d, $J = 6.9$ Hz, 6H)			
3-18	(i)	P-1とP-2の混合物	4 : 6
δ 6.94–7.46 (m, 8H), 6.17 (br, 1H), 3.18 (s, 2H), 3.13–3.17 (m, 1H), 2.55–2.66 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 1.64 (s, 6H), 1.50–1.64 (m, 2H), 1.11 (d, $J = 6.9$ Hz, 6H), 0.95–1.20 (m, 6H), 0.75–0.95 (m, 3H)			
δ 6.94–7.46 (m, 8H), 4.17 (s, 1H), 3.30 (s, 2H), 2.55–2.66 (m, 2H), 2.40–2.60 (m, 1H), 2.36 (s, 3H), 1.55 (s, 6H), 1.50–1.64 (m, 2H), 1.11 (d, $J = 7.2$ Hz, 6H), 0.95–1.20 (m, 6H), 0.75–0.95 (m, 3H)			
3-19	(i)	P-2	
δ 7.25–7.15 (m, 1H), 6.95–7.05 (m, 1H), 6.85–7.05 (m, 2H), 3.13 (s, 2H), 3.05 (s, 2H), 2.59 (sep, $J = 7.2$ Hz, 1H), 2.29 (s, 3H), 1.51 (s, 6H), 1.09 (d, $J = 6.9$ Hz, 6H)			
3-20	(i)	P-1とP-2の混合物	5 : 5

δ 6.88–7.47 (m, 8H), 6.14 (br, 1H), 3.21 (s, 2H), 3.13–3.20 (m, 1H), 2.52–2.65 (m, 2H), 2.26 (s, 3H), 1.64 (s, 6H), 1.49–1.63 (m, 2H), 1.21–1.39 (m, 6H), 0.95–1.05 (m, 6H), 0.82–0.93 (m, 3H)

δ 6.88–7.47 (m, 8H), 4.12 (s, 1H), 2.52–2.65 (m, 2H), 2.40–2.55 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 1.55 (s, 6H), 1.49–1.63 (m, 2H), 1.21–1.39 (m, 6H), 1.05–1.15 (m, 6H), 0.82–0.93 (m, 3H)

3-21 (i) P-1

7.95–8.0 (m, 2H), 7.6–7.7 (m, 1H), 7.45–7.55 (m, 2H), 7.0–7.1 (m, 1H), 6.9–7.0 (m, 1H), 6.6–6.7 (m, 1H), 6.56 (s, 1H), 6.6.03 (s, 1H), 3.09 (s, 2H), 2.92 (sep, J = 6.9 Hz, 1H), 2.22 (s, 3H), 1.64 (s, 6H), 1.25 (d, J 6.9 Hz, 6H)

3-22 (i) P-2

δ 7.2–7.3 (m, 2H), 7.0–7.1 (m, 2H), 3.14 (s, 2H), 3.06 (s, 2H), 2.50–2.65 (m, 1H), 1.52 (s, 6H), 1.29 (s, 9H), 1.08 (d, J 6.9 Hz, 6H)

3-23 (i) P-1とP-2の混合物 5 : 5

δ 6.90–7.47 (m, 8H), 6.13 (br, 1H), 3.20 (s, 2H), 3.05–3.19 (m, 1H), 2.52–2.67 (m, 2H), 1.65 (s, 6H), 1.52–1.63 (m, 2H), 1.22–1.41 (m, 6H), 1.27 (s, 9H), 0.94–1.09 (m, 6H), 0.83–0.93 (m, 3H)

δ 6.90–7.47 (m, 8H), 4.13 (s, 1H), 3.05–3.19 (m, 2H), 2.52–2.67 (m, 2H), 2.39–2.51 (m, 1H), 1.65 (s, 6H), 1.52–1.63 (m, 2H), 1.22–1.41 (m, 6H), 1.31 (s, 9H), 0.94–1.09 (m, 6H), 0.83–0.93 (m, 3H)

[0225] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
¹ H NMRケミカルシフト値 又は融点			

3-24 (i) P-2

δ 7.12–7.30 (m, 5H), 3.63 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 3.10 (s, 2H), 2.50–2.6

5 (m, 1H), 1.56 (s, 3H), 1.40 (s, 3H), 1.26 (d, J = 7.2 Hz, 3H), 1.08 (d, J = 7.2 Hz, 3H), 1.56 (d, J = 6.9 Hz, 3H)

3-25 (i) P-1とP-2の混合物 5 : 5

δ 6.88-7.45 (m, 9H), 6.07 (br, 1H), 3.93-4.06 (m, 1H), 3.11 (sep, J = 7.2 Hz, 1H), 2.52-2.65 (m, 2H), 1.81-1.20 (m, 8H), 1.59 (s, 6H), 0.83-1.20 (m, 12H)

δ 6.88-7.45 (m, 9H), 4.11 (s, 1H), 3.68-3.77 (m, 1H), 2.52-2.65 (m, 2H), 2.35-2.52 (m, 1H), 1.81-1.20 (m, 8H), 1.59 (s, 6H), 0.83-1.20 (m, 12H)

3-27 (ii) P-1とP-3の混合物 9 : 1

δ 9.63 (s, 1H), 7.36 (d, J = 7.7 Hz, 2H), 7.05-7.3 (m, 5H), 6.98 (d, J = 7.4 Hz, 2H), 2.45-2.6 (m, 2H), 1.84 (s, 6H), 1.7-1.9 (m, 1H), 1.45-1.65 (m, 2H), 1.2-1.35 (m, 6H), 0.7-1.05 (m, 7H)

δ 9.45-9.55 (br, 1H), 7.5-7.6 (m, 2H), 7.05-7.3 (m, 5H), 6.98 (d, J = 7.4 Hz, 2H), 2.45-2.6 (m, 2H), 1.84 (s, 6H), 1.7-1.9 (m, 1H), 1.45-1.65 (m, 2H), 1.2-1.35 (m, 6H), 0.7-1.05 (m, 7H)

3-28 (ii) P-1とP-3の混合物 1 : 9

δ 9.7-9.8 (br, 1H), 7.34 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.1-7.3 (m, 4H), 7.00 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 3.05-3.2 (m, 1H), 2.4-2.6 (m, 2H), 1.82 (s, 6H), 1.5-1.6 (m, 2H), 1.2-1.35 (m, 6H), 1.14 (d, J = 6.8 Hz, 6H), 0.75-0.9 (m, 3H)

δ 9.56 (s, 1H), 7.34 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.1-7.3 (m, 4H), 7.00 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 2.95-3.05 (m, 1H), 2.4-2.6 (m, 2H), 1.87 (s, 6H), 1.5-1.6 (m, 2H), 1.2-1.35 (m, 6H), 1.14 (d, J = 6.8 Hz, 6H), 0.75-0.9 (m, 3H)

3-29 (ii) P-1とP-3の混合物 9 : 1

δ 9.67 (s, 1H), 7.3-7.4 (m, 4H), 7.17 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.00 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 2.4-2.6 (m, 2H), 1.7-1.9 (m, 1H), 1.83 (s, 6H), 1.45-1.6

5 (m, 2H), 1.2-1.35 (m, 6H), 0.7-1.1 (m, 7H)

δ 9.45-9.55 (br, 1H), 7.5-7.6 (m, 2H), 7.3-7.4 (m, 2H), 7.17 (d, J = 7.5 Hz 2H), 7.00 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 2.4-2.6 (m, 2H), 1.7-1.9(m, 1H)
1.83 (s, 6H), 1.45-1.65 (m, 2H), 1.2-1.35 (m, 6H), 0.7-1.1 (m, 7H)

3-30 (ii) P-1

δ 9.88 (br, 1H), 7.66 (d, J = 7.4 Hz, 2H), 7.59 (d, J = 7.7 Hz, 2H),
7.3-7.55 (m, 7H), 7.1-7.2 (m, 6H), 2.4-2.6 (m, 2H), 1.96 (s, 6H), 1.5
-1.65 (m, 2H), 1.2-1.4 (m, 6H), 0.85 (t, J = 6.9 Hz, 3H)

3-31 (ii) P-1

δ 9.70 (s, 1H), 7.65-8.05 (m, 6H), 7.0-7.6 (m, 7H), 2.4-2.55 (m, 2H),
1.91 (s, 6H), 1.3-1.55 (m, 2H), 1.1-1.3 (m, 6H), 0.7-0.9 (m, 3H)

3-32 (ii) P-1

δ 9.80 (s, 1H), 7.25-7.4 (m, 6H), 7.05-7.15 (m, 6H), 2.45-2.6 (m, 2H)
, 1.93 (s, 6H), 1.45-1.65 (m, 2H), 1.2-1.35 (m, 6H), 1.26 (s, 9H), 0.
8-0.9 (m, 3H)

3-33 (ii) P-1とP-3の混合物 7 : 3

δ 9.75 (s, 1H), 7.15-7.4 (m, 6H) 6.83 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 3.12 (s, 2
H), 2.84 (sep, J = 6.8 Hz, 1H), 2.57 (t, J = 7.5 Hz 2H), 1.53 (s, 6H)
, 1.4-1.65 (m, 2H), 1.2-1.4 (m, 6H), 1.00 (d, J = 6.8 Hz, 6H), 0.8-0.
9 (m, 3H)

δ 9.31 (s, 1H), 7.15-7.4 (m, 6H) 7.05 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 3.20 (s, 2
H), 2.9-3.05 (m, 1H), 2.57 (t, J = 7.5 Hz 2H), 1.51 (s, 6H), 1.4-1.65
(m, 2H), 1.2-1.4 (m, 6H), 1.05 (d, J = 7.1 Hz, 6H), 0.8-0.9 (m, 3H)

[0226] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
¹ H NMRケミカルシフト値 又は融点			

3-34 (ii) P-1とP-3の混合物 7 : 3

δ 9.88 (s, 1H), 7.40 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.15-7.3 (m, 4H), 6.85 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 3.12 (s, 2H), 2.57 (t, J = 7.4 Hz, 2H), 1.65-1.75(m, 1H), 1.55-1.65(m, 2H), 1.49 (s, 6H), 1.2-1.4 (m, 6H), 0.87 (t, J = 6.8 Hz, 3H), 0.55-0.75 (m, 4H)

δ 9.06 (s, 1H), 7.63 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 7.15-7.3 (m, 4H), 7.07 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 3.22 (s, 2H), 2.57 (t, J = 7.4 Hz, 2H), 1.65-1.75(m, 1H), 1.55-1.65(m, 2H), 1.43 (s, 6H), 1.2-1.4 (m, 6H), 0.87 (t, J = 6.8 Hz, 3H), 0.55-0.75 (m, 4H)

3-35 (ii) P-1とP-3の混合物 6 : 4

δ 9.51 (s, 1H), 7.14 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 6.72 (d, J = 8.2Hz, 2H), 3.06 (s, 2H), 2.69 (sep, J = 6.9Hz, 1H), 2.15-2.3 (m, 2H), 1.46 (s, 6H), 1.4-1.6 (m, 2H), 1.05 (d, J = 6.9 Hz, 6H), 0.88 (t, J = 7.1 Hz, 3H)

δ 8.78 (s, 1H), 7.22 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.00 (d, J = 8.5Hz, 2H), 3.16 (s, 2H), 2.69 (sep, J = 6.9Hz, 1H),, 2.05-2.15 (m, 2H), 1.42 (s, 6H), 1.4-1.6 (m, 2H), 1.05 (d, J = 6.9 Hz, 6H), 0.88 (t, J = 7.1 Hz, 3H)

3-36 (ii) P-1

δ 10.14 (s, 1H), 7.63 (d, J = 7.7 Hz, 2H), 7.52 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.1-7.5 (m, 11H), 6.97 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 3.24 (s, 2H), 2.45-2.65 (m, 2H), 1.61 (s, 6H), 1.5-1.65 (m, 2H), 1.2-1.4 (m, 6H), 0.8-0.9 (m, 3H)

3-37 (ii) P-1とP-3の混合物 9 : 1

δ 10.04 (s, 1H), 7.0-7.65 (m, 10H), 6.94 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 3.21 (s, 2H), 2.45-2.65 (m, 2H), 1.59 (s, 6H), 1.45-1.6 (m, 2H), 1.2-1.35 (m, 6H), 1.22 (s, 9H), 0.8-0.95 (m, 3H)

δ 9.85-9.95 (m, 1H), 6.9-7.65 (m, 10H), 3.21 (s, 2H), 2.45-2.65 (m, 2H), 1.59 (s, 6H), 1.45-1.6 (m, 2H), 1.2-1.35 (m, 6H), 1.23 (s, 9H), 0

.8-0.95 (m, 3H)

3-38 (ii) P-1とP-3の混合物 8 : 2

δ 9.66 (s, 1H), 7.1-7.25 (m, 4H) 6.76 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 6.70 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 3.68 (s, 3H), 3.06 (s, 2H), 2.75-2.9 (m, 1H), 2.57 (t, J = 7.4 Hz, 2H), 1.5-1.65 (m, 2H), 1.50 (s, 6H), 1.2-1.4 (m, 6H), 1.02 (d, J = 6.9 Hz, 6H), 0.87 (t J = 6.9 Hz, 3H)

δ 9.25-9.35 (br, 1H), 7.25-7.35 (m, 4H), 6.85-6.95 (m, 4H), 3.68 (s, 3H), 3.12 (s, 2H), 2.9-3.05 (m, 1H), 2.57 (t, J = 7.4 Hz 2H), 1.5-1.65 (m, 2H), 1.50 (s, 6H), 1.2-1.4 (m, 6H), 1.07 (d, J = 7.1 Hz, 6H), 0.87 (t J = 6.9 Hz, 3H)

3-39 (ii) P-2

δ 7.4-7.55 (m, 2H) 7.20 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 6.84 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 6.73 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 3.69 (s, 3H), 3.08 (s, 2H), 2.5-2.6 (m, 2H), 1.65-1.8 (m, 1H), 1.55-1.65 (m, 2H), 1.45 (s, 6H), 1.2-1.4 (m, 6H), 0.8-1.0 (m, 3H), 0.7-0.8 (m, 2H), 0.6-0.7 (m, 2H)

3-40 (ii) P-1

δ 10.0-10.1 (m, 1H), 7.75 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 6.85-7.7 (m, 13H), 6.76 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 3.71 (s, 3H), 3.05-3.25 (m, 2H), 2.45-2.65 (m, 2H), 1.45-1.65 (m, 8H), 1.15-1.35 (m, 6H), 0.8-0.9 (m, 3H)

[0227] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
¹ H NMRケミカルシフト値 又は融点			

3-41 (ii) P-1とP-3の混合物 7 : 3

δ 10.85 (s, 1H), 6.75-7.3 (m, 12H), 3.73 (s, 3H), 3.05-3.25 (m, 2H), 2.45-2.65 (m, 2H), 1.56 (s, 6H), 1.4-1.65 (m, 2H), 1.2-1.4 (m, 6H), 1.24 (s, 9H), 0.8-0.9 (m, 3H)

δ 9.9–10.0 (m, 1H), 6.75–7.65 (m, 12H), 3.67 (s, 3H), 3.05–3.25 (m, 2H), 2.45–2.65 (m, 2H), 1.56 (s, 6H), 1.4–1.65 (m, 2H), 1.2–1.4 (m, 6H), 1.24 (s, 9H), 0.8–0.9 (m, 3H)

3-43 (i) P-1

δ 7.9–8.0 (m, 2H), 7.6–7.7 (m, 1H), 7.45–7.55 (m, 2H), 7.20 (d, $J = 8.3$ Hz, 2H), 6.74 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 6.04 (s, 1H), 3.10 (s, 2H), 2.83–3.00 (m, 1H), 1.64 (s, 6H), 1.25 (s, 9H), 1.24 (d, $J = 7.2$ Hz, 6H)

3-44 (i) P-1とP-2の混合物 1 : 9

δ 7.01–7.40 (m, 5H), 5.84 (br, 1H), 3.0–3.25 (m, 2H), 2.75–2.91 (m, 1H), 2.2–2.3 (m, 2H), 1.52 (s, 6H), 1.45–1.91 (m, 2H), 1.01–1.44 (m, 6H), 0.83–1.01 (m, 3H)

δ 7.01–7.40 (m, 5H), 3.00–3.28 (m, 3H), 2.45–2.65 (m, 1H), 1.52 (s, 6H), 1.45–1.91 (m, 2H), 1.01–1.44 (m, 6H), 0.83–1.01 (m, 3H)

3-45 (i) P-1

δ 7.85–7.95 (m, 2H), 7.35–7.45 (m, 2H), 7.1–7.3 (m, 5H), 3.94 (br, 1H), 3.2–3.3 (m, 1H), 3.05–3.15 (m, 1H), 1.85–2.0 (m, 2H), 1.57 (s, 3H), 1.55 (s, 3H), 1.33 (s, 9H), 0.95–1.19 (m, 8H), 0.74–0.82 (m, 3H)

3-46 (i) P-2

δ 7.05–7.2 (m, 1H), 6.95–7.05 (m, 1H), 6.85–6.95 (m, 2H), 4.64 (s, 1H), 2.92–3.13 (m, 2H), 2.73–2.89 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 1.46–1.61 (m, 6H), 1.06–1.19 (m, 6H)

3-47 (i) P-2

δ 7.06–7.29 (m, 5H), 4.64 (s, 1H), 3.12 (d, $J = 13.4$ Hz, 1H), 3.03 (d, $J = 13.4$ Hz, 1H), 2.73–2.88 (m, 1H), 1.53 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.16 (d, $J = 6.9$ Hz, 3H), 1.13 (d, $J = 7.2$ Hz, 3H)

3-48 (i) P-1とP-2の混合物 5 : 5

δ 6.89–7.47 (m, 8H), 6.13 (br, 1H), 3.20 (s, 2H), 3.12–3.19 (m, 1H), 2.49–2.65 (m, 4H), 1.63 (s, 6H), 1.45–1.62 (m, 4H), 1.20–1.43 (m, 12H)

), 0.96-1.19 (m, 6H), 0.81-0.93 (m, 6H)

δ 6.89-7.47 (m, 8H), 4.11 (s, 1H), 3.11 (s, 2H), 2.49-2.65 (m, 4H), 2.35-2.50 (m, 1H), 1.54 (s, 6H), 1.45-1.62 (m, 4H), 1.20-1.43 (m, 12H), 0.96-1.19 (m, 6H), 0.81-0.93 (m, 6H)

3-49 (i) P-1

δ 7.13-7.19 (m, 3H), 6.73-6.82 (m, 2H), 5.95 (s, 1H), 3.07 (s, 2H), 2.87 (sep, J = 6.9 Hz, 1H), 2.15 (s, 3H), 1.58 (s, 6H), 1.21 (d, J = 7.2 Hz, 6H)

4-01 (i) P-2

δ 7.18-7.34 (m, 5H), 3.75 (s, 3H), 3.48 (s, 2H), 3.41 (s, 2H), 1.87 (s, 6H)

4-03 (i) P-1

δ 7.08-7.30 (m, 7H), 6.87-6.76 (m, 2H), 3.25 (s, 3H), 3.11 (s, 2H), 2.95 (sep, J = 6.9 Hz, 1H), 2.62 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 1.63 (s, 6H), 1.51-1.70 (m, 2H), 1.21-1.42 (m, 6H), 1.15 (d, J = 6.8 Hz, 6H), 0.89 (t, J = 6.8 Hz, 3H)

[0228] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
¹ H NMRケミカルシフト値 又は融点			

4-12 (ii) P-1とP-3の混合物 8 : 2

δ 9.26 (s, 1H), 7.1-7.3 (m, 3H), 6.89 (d, J = 6.9Hz, 2H), 2.82 (sep, J = 6.9Hz, 1H), 2.20 (t, J = 7.8Hz, 2H), 1.82 (s, 6H), 1.37 (m, 2H), 1.19 (d, J = 7.3 Hz, 6H), 0.8-0.9 (m, 3H)

δ 9.23 (s, 1H), 7.1-7.3 (m, 3H), 7.04 (d, J = 7.0Hz, 2H), 2.8-3.0 (m, 1H), 2.0-2.15 (m, 2H), 1.79 (s, 6H), 1.37 (m, 2H), 1.21 (d, J = 6.9 Hz, 6H), 0.8-0.9 (m, 3H)

4-13 (ii) P-1

δ 9.87 (s, 1H), 7.66 (d, $J = 7.7\text{Hz}$, 2H), 7.59 (d, $J = 8.3\text{Hz}$, 2H), 7.1–7.5 (m, 10H), 2.5–2.6 (m, 2H), 1.97 (s, 6H), 1.5–1.6 (m, 2H), 1.2–1.4 (m, 6H), 0.7–0.9 (m, 3H)

4-14 (ii) P-1とP-2の混合物 6 : 4

δ 9.68 (s, 1H), 7.0–8.0 (m, 14H), 2.4–2.6 (m, 2H), 1.92 (s, 6H), 1.0–1.5 (m, 8H), 0.7–0.9 (m, 3H)

δ 7.0–8.0 (m, 14H), 3.31 (s, 1H), 2.4–2.6 (m, 2H), 1.87 (s, 6H), 1.0–1.5 (m, 8H), 0.7–0.9 (m, 3H)

4-15 (ii) P-1

δ 9.78 (s, 1H), 7.05–7.35 (m, 13H), 2.5–2.6 (m, 2H), 1.95 (s, 6H), 1.5–1.6 (m, 2H), 1.28 (s, 9H), 1.2–1.4 (m, 6H), 0.7–0.9 (m, 3H)

4-16 (ii) P-1

δ 9.59 (s, 1H), 7.55 (d, $J = 8.6\text{Hz}$, 2H), 7.41 (d, $J = 8.6\text{Hz}$, 2H), 7.1–7.35 (m, 3H), 7.00 (d, $J = 7.0\text{Hz}$, 2H), 2.4–2.5 (m, 2H), 1.90 (s, 6H), 1.8–1.9 (m, 2H), 1.05–1.45 (m, 6H), 1.31 (s, 9H), 0.7–0.9 (m, 3H)

4-17 (ii) P-1とP-3の混合物 1 : 6

δ 9.63 (s, 1H), 7.54 (d, $J = 8.0\text{Hz}$, 2H), 7.35–7.45 (m, 4H), 7.41 (d, $J = 8.6\text{Hz}$, 2H), 2.4–2.5 (m, 2H), 1.88 (s, 6H), 1.8–1.9 (m, 2H), 1.0–1.4 (m, 6H), 1.30 (s, 9H), 0.7–0.8 (m, 3H)

δ 9.7–9.8 (m, 1H), 7.83 (d, $J = 8.5\text{Hz}$, 2H), 7.1–7.6 (m, 6H), 2.4–2.5 (m, 2H), 1.88 (s, 6H), 1.8–1.9 (m, 2H), 1.0–1.4 (m, 6H), 1.30 (s, 9H), 0.7–0.8 (m, 3H)

4-18 (ii) P-1とP-3の混合物 8 : 2

δ 9.96 (s, 1H), 7.3–7.7 (m, 9H), 7.19 (d, $J = 8.4\text{ Hz}$, 2H), 6.87 (d, $J = 8.4\text{ Hz}$, 2H), 3.20 (s, 2H), 2.45–2.6 (m, 2H), 1.56 (s, 6H), 1.35–1.55 (m, 2H), 1.2–1.35 (m, 6H), 0.8–0.9 (m, 3H)

δ 9.45 (br, 1H), 7.78 (d, $J = 8.6\text{ Hz}$, 2H), 7.1–7.7 (m, 11H), 3.26 (s,

2H), 2.45-2.6 (m, 2H), 1.50 (s, 6H), 1.35-1.55 (m, 2H), 1.2-1.35 (m, 6H), 0.8-0.9 (m, 3H)

4-19 (ii) P-1とP-3の混合物 8 : 2

δ 9.87 (s, 1H), 6.8-7.9 (m, 8H), 3.17 (s, 2H), 2.4-2.55 (m, 2H), 1.53 (s, 6H), 1.28 (s, 9H), 1.0-1.5 (m, 8H), 0.7-0.9 (m, 3H)

δ 9.3-9.4 (m, 1H), 6.8-7.9 (m, 8H), 3.23 (s, 2H), 2.2-2.4 (m, 2H), 1.47 (s, 6H), 1.25 (s, 9H), 1.0-1.5 (m, 8H), 0.7-0.9 (m, 3H)

[0229] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
-----	------	-------	-----

¹H NMRケミカルシフト値 又は融点

4-20 (ii) P-1とP-3の混合物 6 : 4

δ 9.90 (s, 1H), 7.3-7.7 (m, 9H), 6.80 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.70 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 3.67 (s, 3H), 3.13 (s, 2H), 2.4-2.6 (m, 2H), 1.54 (s, 6H), 1.4-1.6 (m, 2H), 1.0-1.2 (m, 6H), 0.7-0.9 (m, 3H)

δ 9.4-9.5 (m, 1H), 6.6-7.8 (m, 13H), 3.68 (s, 3H), 3.17 (s, 2H), 2.4-2.6 (m, 2H), 1.48 (s, 6H), 1.28 (s, 9H), 1.4-1.6 (m, 2H), 1.0-1.2 (m, 6H), 0.7-0.9 (m, 3H)

4-21 (ii) P-1とP-3の混合物 7 : 3

δ 9.80 (s, 1H), 6.6-7.9 (m, 8H), 3.67 (s, 3H), 3.11 (s, 2H), 2.4-2.6 (m, 2H), 1.51 (s, 6H), 1.28 (s, 9H), 1.0-1.6 (m, 8H), 0.7-0.9 (m, 3H)

δ 9.35 (m, 1H), 6.6-7.9 (m, 8H), 3.68 (s, 3H), 3.15 (s, 2H), 2.2-2.4 (m, 2H), 1.45 (s, 6H), 1.0-1.6 (m, 8H), 1.25 (s, 9H), 0.7-0.9 (m, 3H)

4-22 (ii) P-1とP-3の混合物 6 : 4

δ 9.43 (s, 1H), 6.66 (s, 4H), 3.67 (s, 3H), 3.01 (s, 2H), 2.6-2.8 (m, 2H), 2.2-2.3 (m, 2H), 1.44 (s, 6H), 1.3-1.5 (m, 2H), 1.07 (d, J = 6.8 Hz, 6H), 0.89 (t, J = 7.3 Hz, 3H)

δ 8.78 (s, 1H), 6.91 (d, $J = 8.3$ Hz, 2H), 6.73 (d, $J = 8.3$ Hz, 2H), 3.68 (s, 3H), 3.08 (s, 2H), 2.7-2.9 (m, 2H), 2.0-2.2 (m, 2H), 1.39 (s, 6H), 1.3-1.5 (m, 2H), 1.07 (d, $J = 6.8$ Hz, 6H), 0.89 (t, $J = 7.3$ Hz, 3H)

4-23 (i) P-1とP-2の混合物 9 : 1

δ 8.0-8.1 (m, 2H), 7.6-7.7 (m, 2H), 7.15-7.3 (m, 3H), 7.05-7.15 (m, 2H), 6.37 (br, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.27 (s, 2H), 3.12-3.19 (m, 1H), 1.65 (s, 6H), 1.08 (d, $J = 7.2$ Hz, 6H)

δ 8.0-8.1 (m, 2H), 7.6-7.7 (m, 2H), 7.15-7.3 (m, 3H), 7.05-7.15 (m, 2H), 4.2-4.3 (m, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.1-3.2 (m, 2H), 2.35-2.5 (m, 1H), 1.65 (s, 6H), 0.95-1.05 (m, 6H)

4-27 (i) P-1

δ 9.71 (s, 1H), 7.13-7.33 (m, 3H), 7.05-7.12 (m, 2H), 4.31 (q, $J = 7.1$ Hz, 2H), 3.23 (sep, $J = 6.9$ Hz, 1H), 1.94 (s, 6H), 1.36 (t, 7.3 Hz, 3H), 1.30 (d, $J = 6.8$ Hz, 6H)

4-28 (ii) P-1とP-3の混合物 6 : 4

δ 9.66 (s, 1H), 6.9-8.3 (m, 11H), 3.60 (s, 2H), 2.82 (sep, $J = 6.7$ Hz, 1H), 2.58 (t, $J = 8.0$ Hz, 2H), 1.60 (s, 6H), 1.5-1.7 (m, 2H), 1.2-1.4 (m, 6H), 0.97 (d, $J = 5.9$ Hz, 6H), 0.87 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H)

δ 9.29 (s, 1H), 6.9-8.3 (m, 11H), 3.69 (s, 2H), 2.95 (sep, $J = 6.6$ Hz, 1H), 2.58 (t, $J = 8.0$ Hz, 2H), 1.57 (s, 6H), 1.5-1.7 (m, 2H), 1.2-1.4 (m, 6H), 0.99 (d, $J = 6.3$ Hz, 6H), 0.87 (t, $J = 7.0$ Hz, 3H)

4-29 (ii) P-1とP-3の混合物 7 : 3

δ 9.66 (s, 1H), 6.9-8.3 (m, 11H), 3.60 (s, 2H), 2.82 (sep, $J = 6.5$ Hz, 1H), 2.58 (t, $J = 7.7$ Hz, 2H), 1.59 (s, 6H), 1.5-1.7 (m, 2H), 1.2-1.4 (m, 10H), 0.97 (d, $J = 6.6$ Hz, 6H), 0.86 (t, $J = 6.4$ Hz, 3H)

δ 9.29 (s, 1H), 6.9-8.3 (m, 11H), 3.69 (s, 2H), 2.85-3.0 (m, 1H), 2.58 (t, $J = 7.7$ Hz, 2H), 1.59 (s, 6H), 1.5-1.7 (m, 2H), 1.2-1.4 (m, 10H)

, 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 6H), 0.86 (t, J = 6.4 Hz, 3H)

[0230] 第 2 1 表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
¹ H NMRケミカルシフト値 又は融点			
4-30	(ii)	P-1とP-3の混合物	7 : 3
δ 9.68 (s, 1H), 6.8-8.3 (m, 11H), 3.59 (s, 2H), 2.82 (sep, J = 6.7Hz, 1H), 1.65-1.8 (m, 5H), 1.59 (s, 6H), 1.1-1.5 (m, 6H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 6H)			
δ 9.29 (s, 1H), 6.8-8.3 (m, 11H), 3.69 (s, 2H), 2.85-3.0 (m, 1H), 1.65-1.8 (m, 5H), 1.59 (s, 6H), 1.1-1.5 (m, 6H), 1.04 (d, J = 6.6 Hz, 6H)			
4-31	(ii)	P-1とP-3の混合物	7 : 3
δ 10.17 (s, 1H), 6.3-8.3 (m, 10H), 3.62 (s, 2H), 2.95 (sep, J = 5.2 Hz, 1H), 1.57 (s, 6H), 1.03 (d, J = 5.3 Hz, 6H)			
δ 9.69 (s, 1H), 6.3-8.3 (m, 10H), 3.71 (s, 2H), 3.24 (sep, J = 5.2 Hz, 1H), 1.54 (s, 6H), 1.09 (d, J = 5.3 Hz, 6H)			
4-32	(ii)	P-1とP-3の混合物	5 : 5
δ 9.81 (s, 1H), 8.0-8.15 (m, 1H), 7.7-7.85 (m, 2H), 6.9-7.6 (m, 8H), 3.62 (s, 2H), 2.58 (t, J = 7.9 Hz, 2H), 2.3-2.45 (m, 2H), 1.57 (s, 6H), 1.0-1.4 (m, 16H), 0.85-1.0 (m, 3H), 0.7-0.85 (m, 3H)			
δ 9.72 (s, 1H), 8.25-8.35 (m, 1H), 7.85-7.95 (m, 2H), 6.9-7.6 (m, 8H), 3.72 (s, 2H), 2.58 (t, J = 7.9 Hz, 2H), 2.3-2.45 (m, 2H), 1.54 (s, 6H), 1.0-1.4 (m, 16H), 0.85-1.0 (m, 3H), 0.7-0.85 (m, 3H)			
4-33	(ii)	P-1とP-3の混合物	8 : 2
δ 9.61 (s, 1H), 6.8-8.3 (m, 11H), 3.59 (s, 2H), 2.58 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 2.4-2.55 (m, 1H), 1.59 (s, 6H), 1.0-1.7 (m, 18H), 0.8-0.9 (m, 3H)			

)

δ 9.28 (s, 1H), 6.8–8.3 (m, 11H), 3.69 (s, 2H), 2.58 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 2.4–2.55 (m, 1H), 1.59 (s, 6H), 1.0–1.7 (m, 18H), 0.8–0.9 (m, 3H)

)

4-34 (ii) P-1

δ 10.25 (s, 1H), 8.1–8.2 (m, 1H), 7.8–7.9 (m, 1H), 7.77 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.45–7.55 (m, 3H), 7.35 (t J = 8.1 Hz, 1H), 7.15–7.25 (m, 4H), 7.07 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 6.3–6.4 (m, 1H), 5.95–6.05 (m, 1H), 3.71 (s, 2H), 2.59 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 1.63 (s, 6H), 1.45–1.7 (m, 2H), 1.2–1.45 (m, 6H), 0.8–0.9 (m, 3H)

4-35 (ii) P-1とP-3の混合物 8 : 2

δ 9.74 (s, 1H), 7.1–7.35 (m, 5H), 6.8–6.95 (m, 1H), 6.6–6.7 (m, 1H), 3.42 (s, 2H), 2.89(sep, J = 6.5Hz, 1H), 2.57 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 1.57 (s, 6H), 1.45–1.65 (m, 2H), 1.2–1.4 (m, 6H), 1.06 (d, J = 6.5 Hz, 6H), 0.8–0.9 (m, 3H)

δ 9.41 (s, 1H), 7.1–7.35 (m, 5H), 6.8–6.95 (m, 1H), 6.7–6.8 (m, 1H), 3.48 (s, 2H), 2.95–3.1 (m, 1H), 2.57 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 1.57 (s, 6H), 1.45–1.65 (m, 2H), 1.2–1.4 (m, 6H), 1.06 (d, J = 6.5 Hz, 6H), 0.8–0.9 (m, 3H)

4-36 (ii) P-1とP-3の混合物 8 : 2

δ 9.74 (s, 1H), 7.1–7.35 (m, 5H), 6.8–6.95 (m, 1H), 6.6–6.7 (m, 1H), 3.43 (s, 2H), 2.8–2.95 (m, 1H), 2.57 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 1.52 (s, 6H), 1.5–1.65 (m, 2H), 1.2–1.4 (m, 10H), 1.06 (d, J = 6.2 Hz, 6H), 0.85 (t, J = 6.9 Hz, 3H)

δ 9.45–9.55 (m, 1H), 7.1–7.35 (m, 5H), 6.8–6.95 (m, 1H), 6.7–6.8 (m, 1H), 3.47 (s, 2H), 2.95–3.1 (m, 1H), 2.57 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 1.52 (s, 6H), 1.5–1.65 (m, 2H), 1.2–1.4 (m, 10H), 1.06 (d, J = 6.2 Hz, 6H), 0.85 (t, J = 6.9 Hz, 3H)

[0231] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
¹ H NMRケミカルシフト値 又は融点			
4-37	(ii)	P-1とP-3の混合物	7 : 3
δ 9.76 (s, 1H), 7.1-7.35 (m, 5H), 6.8-6.95 (m, 1H), 6.6-6.8 (m, 1H), 3.42 (s, 2H), 2.89 (sep, J = 6.5 Hz, 1H), 2.4-2.55 (m, 1H), 1.65-1.9 (m, 5H), 1.52 (s, 6H), 1.1-1.5 (m, 5H), 1.07 (d, J = 6.6 Hz, 6H) δ 9.41 (s, 1H), 7.1-7.35 (m, 5H), 6.8-6.95 (m, 1H), 6.6-6.8 (m, 1H), 3.4-3.5 (m, 2H), 2.95-3.1 (m, 1H), 2.4-2.55 (m, 1H), 1.65-1.9 (m, 5H) , 1.52 (s, 6H), 1.1-1.5 (m, 5H), 1.07 (d, J = 6.6 Hz, 6H)			
4-38	(ii)	P-1とP-3の混合物	7 : 3
δ 10.15 (s, 1H), 7.61 (s, 1H), 7.26 (d, J = 3.8 Hz, 1H), 6.6-6.95 (m, 2H), 6.50 (s, 1H), 6.32 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.42 (s, 2H), 3.02 (sep , J = 5.2 Hz, 1H), 1.52 (s, 6H), 1.12 (d, J = 5.2 Hz, 6H) δ 9.82 (s, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.29 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 6.6-6.95 (m, 2H), 6.50 (s, 1H), 6.32 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 3.50 (s, 2H), 3.02 (sep, J = 5.2 Hz, 1H), 1.50 (s, 6H), 1.19 (d, J = 5.3 Hz, 6H)			
4-39	(ii)	P-1	
δ 9.84 (s, 1H), 7.1-7.5 (m, 5H), 6.8-6.95 (m, 1H), 6.6-6.8 (m, 1H), 3 .4-3.6 (m, 2H), 2.56 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 2.3-2.45 (m, 2H), 1.50 (s, 6H), 1.05-1.65 (m, 16H), 0.75-0.9 (m, 6H)			
4-40	(ii)	P-1とP-3の混合物	7 : 3
δ 9.70 (s, 1H), 7.1-7.35 (m, 5H), 6.8-6.95 (m, 1H), 6.6-6.8 (m, 1H), 3.42 (s, 2H), 2.57 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 2.4-2.55 (m, 1H), 1.52 (s, 6H), 1.05-1.75 (m, 18H), 0.8-0.9 (m, 3H) δ 9.34 (s, 1H), 7.1-7.35 (m, 5H), 6.8-6.95 (m, 1H), 6.6-6.8 (m, 1H),			

3.48 (s, 2H), 2.57 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 2.4-2.55 (m, 1H), 1.52 (s, 6H), 1.05-1.75 (m, 18H), 0.8-0.9 (m, 3H)

4-41 (ii) P-1

δ 10.30 (s, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.28 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 7.20 (s, 4H), 6.90 (t, J = 3.5 Hz, 1H), 6.73 (s, 1H), 6.38 (s, 1H), 6.07 (s, 1H), 3.50 (s, 2H), 2.59 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 1.58 (s, 6H), 1.5-1.65 (m, 2H), 1.2-1.4 (m, 6H), 0.8-0.9 (m, 3H)

4-42 (ii) P-1とP-3の混合物 9 : 1

δ 9.57 (s, 1H), 7.1-7.25 (m, 4H), 2.87 (sep, J = 7.1 Hz, 1H), 2.56 (t, J = 8.0 Hz, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.45-1.85 (m, 13H), 1.25-1.4 (m, 12H), 1.10 (d, J = 6.8 Hz, 6H), 0.8-0.9 (m, 3H)

δ 9.60 (s, 1H), 7.1-7.25 (m, 4H), 3.0-3.15 (m, 1H), 2.56 (t, J = 8.0 Hz, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.45-1.85 (m, 13H), 1.25-1.4 (m, 12H), 1.21 (d, J = 7.1 Hz, 6H), 0.8-0.9 (m, 3H)

4-43 (ii) P-1

δ 9.57 (s, 1H), 7.17 (s, 4H), 2.8-2.95 (m, 1H), 2.56 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.2-1.9 (m, 29H), 1.10 (d, J = 6.7 Hz, 6H), 0.86 (t, J = 7.2 Hz, 3H)

4-44 (ii) P-1

δ 9.58 (s, 1H), 7.19 (dd, J = 8.2 Hz, 13.4 Hz, 4H), 2.8-2.95 (m, 1H), 2.4-2.55 (m, 1H), 1.61 (s, 6H), 1.15-1.9 (m, 27H), 1.11 (d, J = 6.8 Hz, 6H)

[0232] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
¹ H NMRケミカルシフト値 又は融点			

4-45	(ii)	P-1とP-3の混合物	8 : 2

δ 9.94 (s, 1H), 7.58 (s, 1H), 6.4–6.5 (m, 1H), 6.27(d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.02 (sep, J = 5.2 Hz, 1H), 1.64 (s, 6H), 1.3–1.85 (m, 17H), 1.13 (d, J = 5.1 Hz, 6H)

δ 9.94 (s, 1H), 7.56 (s, 1H), 6.67 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 6.4–6.5 (m, 1H), 3.35–3.45 (m, 1H), 1.64 (s, 6H), 1.3–1.85 (m, 17H), 1.26 (d, J = 5.3 Hz, 6H)

4-46 (ii) P-1

δ 9.64 (s, 1H), 7.36 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 2.45–2.65 (m, 4H), 1.59 (s, 6H), 1.05–1.85 (m, 33H), 0.7–0.9 (m, 6H)

4-47 (ii) P-1

δ 9.53 (s, 1H), 7.1–7.2 (m, 4H), 2.56 (t, J = 8.0 Hz, 2H), 2.45–2.55 (m, 1H), 1.61 (s, 6H), 1.1–1.8 (m, 35H), 0.86 (t, J = 6.8 Hz, 3H)

4-48 (ii) P-1

δ 10.04 (s, 1H), 7.56 (s, 1H), 7.17 (s, 4H), 6.40 (s, 1H), 6.09 (d, J = 2.9 Hz, 1H), 2.58 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 1.75–1.9 (m, 6H), 1.65 (s, 6H), 1.2–1.7 (m, 19H), 0.8–0.95 (m, 3H)

4-49 (ii) P-1とP-3の混合物 6 : 4

δ 10.21 (s, 1H), 7.2–7.4 (m, 7H), 7.05 (d, J = 4.9 Hz, 2H), 2.93 (s, 2H), 2.8–2.9(m, 1H), 2.5–2.6 (m, 2H), 1.5–1.65 (m, 2H), 0.9–1.35 (m, 16H), 0.86 (t, J = 5.3 Hz, 3H)

δ 9.73 (s, 1H), 7.2–7.4 (m, 7H), 6.96 (d, J = 4.6 Hz, 2H), 2.99 (s, 2H), 2.9–3.05 (m, 1H), 2.5–2.6 (m, 2H), 1.5–1.65 (m, 2H), 0.9–1.35 (m, 16H), 0.86 (t, J = 5.3 Hz, 3H)

4-50 (ii) P-1とP-3の混合物 6 : 4

δ 10.21 (s, 1H), 7.1–7.3 (m, 7H), 7.05 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 2.93 (s, 2H), 2.8–2.9 (m, 1H), 2.5–2.6 (m, 2H), 1.5–1.6 (m, 2H), 0.9–1.35 (m, 20H), 0.86 (t, J = 5.4 Hz, 3H)

δ 9.72 (s, 1H), 7.1–7.3 (m, 7H), 6.95 (d, J = 4.3 Hz, 2H), 2.99 (s, 2

H), 2.9–3.0 (m, 1H), 2.5–2.6 (m, 2H), 1.5–1.6 (m, 2H), 0.9–1.35 (m, 20H), 0.86 (t, J = 5.4 Hz, 3H)

4-51 (ii) P-1とP-3の混合物 6 : 4

δ 10.21 (s, 1H), 7.1–7.3 (m, 7H), 7.05 (d, J = 4.6 Hz, 2H), 2.93 (s, 2H), 2.8–2.9 (m, 1H), 2.4–2.6 (m, 1H), 1.75–1.85 (m, 4H), 0.95–1.5 (m, 16H)

δ 9.74 (s, 1H), 7.1–7.3 (m, 7H), 6.9–7.0 (m, 2H), 2.98 (s, 2H), 2.9–3.0 (m, 1H), 2.4–2.6 (m, 1H), 1.65–1.75 (m, 4H), 0.95–1.5 (m, 16H)

4-52 (ii) P-1とP-3の混合物 6 : 4

δ 10.57 (s, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.1–7.25 (m, 5H), 7.04 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 6.62 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.45–6.5 (m, 1H), 2.92 (s, 2H), 2.9–3.05 (m, 1H), 1.0–1.25 (m, 8H), 0.85–1.0 (m, 2H)

δ 10.21 (s, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.1–7.25 (m, 5H), 6.97 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 6.4–6.5 (m, 1H), 6.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 2.98 (s, 2H), 2.75–2.85 (m, 1H), 1.0–1.25 (m, 8H), 0.85–1.0 (m, 2H)

[0233] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
	^1H NMRケミカルシフト値	又は融点	

4-53 (ii) P-1とP-3の混合物 7 : 3

δ 10.41 (s, 1H), 6.95–7.45 (m, 9H), 2.95–3.1 (m, 2H), 2.55 (t, J = 5.8 Hz, 2H), 2.40 (d, J = 5.8 Hz, 2H), 1.5–1.65 (m, 2H), 1.0–1.4 (m, 16H), 0.75–0.95 (m, 8H)

δ 9.80 (s, 1H), 6.95–7.45 (m, 9H), 2.95–3.1 (m, 2H), 2.55 (t, J = 5.8 Hz, 2H), 2.40 (d, J = 5.8 Hz, 2H), 1.5–1.65 (m, 2H), 1.0–1.4 (m, 16H), 0.75–0.95 (m, 8H)

4-54 (ii) P-1とP-3の混合物 6 : 4

δ 10.22 (s, 1H), 7.1–7.3 (m, 7H), 7.0–7.1 (m, 2H), 2.92 (s, 2H), 2.56 (t, J = 5.8 Hz, 2H), 2.45–2.7 (m, 1H), 1.5–1.65 (m, 8H), 1.25–1.5 (m, 8H), 1.0–1.25 (m, 4H), 0.8–0.95 (m, 5H))

δ 9.69 (s, 1H), 7.1–7.3 (m, 7H), 6.9–7.0 (m, 2H), 2.98 (s, 2H), 2.56 (t, J = 5.8 Hz, 2H), 2.45–2.7 (m, 1H), 1.5–1.65 (m, 8H), 1.25–1.5 (m, 8H), 1.0–1.25 (m, 4H), 0.8–0.95 (m, 5H))

4-55 (ii) P-1

δ 10.21 (s, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.05–7.35 (m, 9H), 6.40 (s, 1H), 6.08 (s, 1H), 3.10 (s, 2H), 2.57 (t, J = 5.8 Hz, 2H), 1.5–1.65 (m, 2H), 1.2–1.4 (m, 6H), 0.9–1.0 (m, 2H), 0.8–0.9 (m, 5H)

4-56 (ii) P-1とP-3の混合物 7 : 3

δ 9.68 (s, 1H), 7.1–7.35 (m, 4H), 6.85–7.1 (m, 2H), 6.65–6.85 (m, 2H), 3.09 (s, 2H), 2.86 (sep, J = 6.8 Hz, 1H), 2.57 (t, J = 7.4 Hz, 2H), 2.22 (s, 3H), 1.50 (s, 6H), 1.4–1.65 (m, 2H), 1.15–1.4 (m, 10H), 1.02 (d, J = 6.2 Hz, 6H), 0.8–0.95 (m, 3H)

δ 9.29 (s, 1H), 7.1–7.35 (m, 4H), 6.85–7.1 (m, 4H), 3.14 (s, 2H), 2.95–3.05 (m, 1H), 2.57 (t, J = 7.4 Hz, 2H), 2.22 (s, 3H), 1.50 (s, 6H), 1.4–1.65 (m, 2H), 1.15–1.4 (m, 10H), 1.0–1.1 (m, 6H), 0.8–0.95 (m, 3H)

4-57 (ii) P-1とP-3の混合物 7 : 3

δ 9.69 (s, 1H), 7.15–7.2 (m, 4H), 6.85–7.0 (m, 2H), 6.73 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 3.09 (s, 2H), 2.85 (sep, J = 6.7 Hz, 1H), 2.45–2.55 (m, 1H), 2.22 (s, 3H), 1.65–1.9 (m, 5H), 1.50 (s, 6H), 1.15–1.5 (m, 5H), 1.02 (d, J = 6.8 Hz, 6H)

δ 9.29 (s, 1H), 7.30 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.15–7.2 (m, 2H), 6.85–7.0 (m, 4H), 3.14 (s, 2H), 2.95–3.05 (m, 1H), 2.45–2.55 (m, 1H), 2.22 (s, 3H), 1.65–1.9 (m, 5H), 1.50 (s, 6H), 1.15–1.5 (m, 5H), 1.06 (d, J = 7.1 Hz, 6H)

4-58 (ii) P-1とP-3の混合物 7 : 3
 δ 10.11 (s, 1H), 7.61 (s, 1H), 6.96 (d, J = 5.6 Hz, 2H), 6.74 (d, J = 5.7 Hz, 2H), 6.50 (s, 1H), 6.32 (s, 1H), 3.10 (s, 2H), 2.98 (sep, J = 5.3 Hz, 1H), 2.22 (s, 3H), 1.49 (s, 6H), 1.07 (d, J = 5.2 Hz, 6H)
 δ 9.70 (s, 1H), 7.59 (s, 1H), 6.85-7.05 (m, 4H), 6.50 (s, 1H), 6.32 (s, 1H), 3.17 (s, 2H), 2.98 (sep, J = 5.3 Hz, 1H), 2.22 (s, 3H), 1.46 (s, 6H), 1.15 (d, J = 4.6 Hz, 6H)

[0234] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
¹ H NMRケミカルシフト値 又は融点			
4-59	(ii)	P-1とP-3の混合物	5 : 5
δ 9.79 (s, 1H), 7.1-7.3 (m, 4H), 6.9-7.05 (m, 2H), 6.77 (d, J = 7.7 Hz, 2H), 3.18 (s, 2H), 2.57 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 2.35-2.5 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 1.49 (s, 6H), 1.55-1.65 (m, 2H), 1.2-1.45 (m, 8H), 1.05-1.2 (m, 6H), 0.85-0.9 (m, 3H), 0.7-0.85 (m, 3H) δ 9.71 (s, 1H), 7.42 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.1-7.3 (m, 4H), 6.9-7.05 (m, 2H), 3.11 (s, 2H), 2.57 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 2.35-2.5 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 1.46 (s, 6H), 1.55-1.65 (m, 2H), 1.2-1.45 (m, 8H), 1.05-1.2 (m, 6H), 0.85-0.9 (m, 3H), 0.7-0.85 (m, 3H)			
4-60	(ii)	P-1とP-3の混合物	7 : 3
δ 9.64 (s, 1H), 7.15-7.25 (m, 4H), 6.85-7.05 (m, 2H), 6.65-6.8 (m, 2H), 3.09 (s, 2H), 2.58 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 2.4-2.65 (m, 1H), 2.22 (s, 3H), 1.45-1.75 (m, 8H), 1.50 (s, 6H), 1.25-1.4 (m, 8H), 1.05-1.25 (m, 2H), 0.8-0.95 (m, 3H) δ 9.2-9.3 (m, 1H), 7.15-7.35 (m, 4H), 6.85-7.05 (m, 4H), 3.1-3.2 (m, 2H), 2.58 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 2.4-2.65 (m, 1H), 2.22 (s, 3H), 1.45-1			

.75 (m, 8H), 1.50 (s, 6H), 1.25-1.4 (m, 8H), 1.05-1.25 (m, 2H), 0.8-0.95 (m, 3H)

4-61 (ii) P-1

δ 10.23 (s, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.20 (s, 4H), 7.00 (d, J = 7.4 Hz, 2H), 6.86 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 6.37 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 6.03 (d, J = 2.82 Hz, 1H), 3.19 (s, 2H), 2.59 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 2.22 (s, 3H), 1.54 (s, 6H), 1.45-1.7 (m, 2H), 1.2-1.45 (m, 6H), 0.8-0.9 (m, 3H)

4-62 (ii) P-1

δ 7.22 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.11 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 6.99 (d, J = 7.7 Hz, 2H), 6.69 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 4.11 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 3.01 (s, 2H), 2.9-3.0 (m, 1H), 2.58 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 2.23 (s, 3H), 1.45-1.65 (m, 2H), 1.51 (s, 6H), 1.2-1.4 (m, 6H), 1.09 (d, J = 6.9 Hz, 6H), 1.07 (t, J = 7.1 Hz, 3H). 0.8-0.9 (m, 3H)

[0235] 第21表 (続き)

No.	測定条件	互変異性体	混合比
¹ H NMRケミカルシフト値 又は融点			

4-71 (i) P-1

δ 7.15-7.63 (m, 8H), 6.90-6.98 (m, 2H), 3.17 (s, 2H), 2.60-2.74 (m, 1H), 1.64 (s, 6H), 0.96 (d, J = 6.9 Hz, 6H)

4-72

融点 117~119°C

4-73

融点 69~71°C

4-74

融点 113~115°C

4-75

融点 102~104℃

4-76

融点 101~103℃

4-80

融点 88~90℃

4-81

融点 58~60℃

4-82

融点 133~135℃

4-83

融点 109~111℃

4-84

融点 108~110℃

4-85

融点 88~90℃

4-86

融点 140~142℃

4-87

融点 108~110℃

4-88 (i) P-1

δ 12.7-13.1 (br, 1H), 7.12-7.21 (m, 3H), 6.84-6.94 (m, 2H), 3.11 (s, 2H), 3.04-3.15 (m, 1H), 2.42 (s, 3H), 1.58 (s, 6H), 1.27 (d, J = 6.9 Hz, 6H)

4-89 (i) P-1

δ 10.7-11.4 (br, 1H), 7.12-7.22 (m, 3H), 6.84-6.95 (m, 2H), 3.87 (s, 3H), 3.16 (s, 2H), 2.98-3.12 (m, 1H), 2.25 (s, 3H), 1.57 (s, 6H), 1.21 (d, J = 6.8 Hz, 6H)

4-90

融点 149～151℃

4-91 (ii) P-1

δ 9.6-9.9 (br, 1H), 7.1-7.25 (m, 3H), 6.8-6.9 (m, 2H), 4.02 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.11 (s, 2H), 3.07 (sep, J = 7.5 Hz, 1H), 2.11 (s, 3H), 1.5-1.7 (m, 2H), 1.49 (s, 6H), 1.2-1.4 (m, 6H), 1.09 (d, J = 6.8 Hz, 6H), 0.87 (t, J = 6.8Hz, 3H)

[0236] [製剤例1]

以下の成分を含有する顆粒剤を製造する

成分： 一般式 (I) で表される化合物 10mg

乳糖 : 700mg

コーンスターチ : 274mg

HPC-L : 16mg

計 1000mg

一般式 (I) で表される化合物と乳糖を60メッシュのふるいに通す。コーンスターチを120メッシュのふるいに通す。これらをV型混合機にて混合する。混合末に低粘度ヒドロキシプロピルセルロース (HPC-L) 水溶液を添加し、練合、造粒 (押し出し造粒 孔径0.5～1mm) した後、乾燥する。得られた乾燥顆粒を振動ふるい (12/60メッシュ) で篩過し顆粒剤を得る。

[製剤例2]

以下の成分を含有するカプセル充填用散剤を製造する。

成分： 一般式 (I) で表される化合物 10mg

乳糖 : 79mg

コーンスターチ : 10mg

ステアリン酸マグネシウム : 1mg

計 100mg

一般式（Ⅰ）で表される化合物と乳糖を60メッシュのふるいに通す。コーンスターチを120メッシュのふるいに通す。これらとステアリン酸マグネシウムをV型混合機にて混合する。10倍散100mgを5号硬ゼラチンカプセルに充填する。

〔製剤例3〕

以下の成分を含有するカプセル充填用顆粒剤を製造する。

成分： 一般式（Ⅰ）で表される化合物 15mg

乳糖： 90mg

コーンスターチ： 42mg

HPC-L： 3mg

計 150mg

一般式（Ⅰ）で表される化合物と乳糖を60メッシュのふるいに通す。コーンスターチを120メッシュのふるいに通す。これらをV型混合機にて混合する。混合末に低粘度ヒドロキシプロピルセルロース（HPC-L）水溶液を添加し、練合、造粒した後、乾燥する。得られた乾燥顆粒を振動ふるい（12/60メッシュ）で篩過し、整粒し、その150mgを4号硬ゼラチンカプセルに充填する。

[0237] 〔製剤例4〕

以下の成分を含有する錠剤を製造する。

成分： 一般式（Ⅰ）で表される化合物 10mg

乳糖： 90mg

微結晶セルロース： 30mg

ステアリン酸マグネシウム： 5mg

CMC-Na： 15mg

計 150mg

一般式（Ⅰ）で表される化合物と乳糖と微結晶セルロース、CMC-Na（カルボキ

シメチルセルロース ナトリウム塩)を60メッシュのふるいに通し、混合する。混合末にステアリン酸マグネシウムを添加し、製剤用混合末を得る。本混合末を直打し、150mgの錠剤を得る。

〔製剤例5〕

静脈用製剤は次のように製造する。

一般式(1)で表される化合物 : 100mg

飽和脂肪酸グリセリド : 1000mL

上記成分の溶液は通常、1分間に1mLの速度で患者に静脈内投与される。

〔試験例〕

次に、本発明化合物の骨髓種細胞増殖阻害剤としての有用性について、以下の試験例において具体的に説明するが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。なお、CO₂インキュベーターにおけるCO₂の濃度(%)は、雰囲気中のCO₂の体積%で示した。

[0238] (試験例：細胞増殖試験)

骨髓腫細胞株RPMI 8226 (DSファーマバイオメディカル社製)を、CO₂インキュベーター(5%CO₂)内で、10%(v/v)胎児ウシ血清を含むRPMI 1640培地を用いて、液体培養した。得られた細胞を、10%(v/v)胎児ウシ血清を含むRPMI 1640培地(GIBCO社製)中に懸濁し、本細胞懸濁液を96ウェル平底マイクロプレート(コーニング社製)に1ウェル当たり100μl/mL(400000細胞/ウェル)となるようにプレーティングした。さらに、ジメチルスルホキシド中に溶解した実施例記載のいずれかの化合物を最終濃度0.1乃至10μg/mLとなるように0.1%(v/v)添加した。この際、陰性対照としては0.1%(v/v)ジメチルスルホキシドを設定した。

37℃で4日間、CO₂インキュベーター(5%CO₂)内で液体培養した後、生細胞数をWST法にて測定した。すなわち、Cell Counting Kit-8溶液(同仁化学社製)を各ウェルに10μlずつ添加した後、CO₂インキュベーター(5%CO₂)内で4時間呈色反応を行い、マイクロプ

レートリーダーを用い、450 nmの吸光度を測定した。引き続き、供試化合物を添加時の細胞増殖活性を、供試化合物を含まない細胞増殖活性（陰性対照）と比較して、供試化合物の細胞増殖阻害活性を算出し、細胞増殖を50%阻害する濃度（IC50）を求めた。その結果、本発明化合物はRPMI 8226細胞に対して優れた増殖阻害活性を示し、骨髓腫細胞の増殖阻害活性を有することが確認された。

RPMI 8226細胞増殖に対する供試化合物のIC50（ $\mu\text{g}/\text{mL}$ ）を第22表に示す。

[0239] 第22表

No.	IC50 ($\mu\text{g}/\text{mL}$)

1-03	4.0
1-07	8.1
3-01	11.1
3-02	11.6
3-03	6.4
3-07	8.8
2-01	10.6
2-03	6.3
2-05	5.3
2-06	10.8
2-07	7.4
2-09	8.9
2-10	8.4
2-12	4.9
2-14	6.6

2-15	5.8
2-16	11.2
2-19	13.4
2-20	38.8
2-21	6.8
2-22	4.2
2-23	0.16
2-24	6.8
2-25	6.2
2-28	68.6
2-29	14.5
2-31	5.7
2-32	4.1
2-33	12.3
2-49	3.6
2-34	6.7
2-35	5.6
2-36	17.7
2-37	3.9
2-39	4.4
2-40	6.5
2-43	7.9
2-44	7.7
2-45	20.7
2-46	3.9
2-47	3.3
2-48	6.4
2-50	3.9

3-05 4.9

3-06 7.7

[0240] 第 2 2 表 (続 き)

No. IC50
(μ g / m L)

3-07 5.3

3-09 4.3

3-10 7.6

3-11 4.8

3-12 5.4

3-13 5.4

3-14 7.9

3-16 3.5

3-17 4.4

3-18 7.4

3-19 4.3

3-20 6.6

3-21 4.5

3-22 3.9

3-23 8.5

3-24 4.2

3-25 7.4

3-27 7.7

3-28 4.9

3-29 5.5

3-30 24.9

3-31	6.4
3-32	27.1
3-33	5.9
3-34	3.2
3-35	3.8
3-38	4.2
3-39	0.4
3-40	76.7
3-41	17.0
3-43	8.0
3-44	3.3
3-45	5.6
3-46	3.3
3-47	3.3
3-49	4.3
4-01	11.1
4-03	6.4
4-12	5.6
4-13	8.3
4-14	3.8
4-15	10.2
4-16	4.2
4-17	5.6

[0241] 第2 2 表 (続き)

No.	IC50
	(μ g / mL)

4-18	5.6
4-19	21.6
4-20	4.8
4-21	6.1
4-22	4.1
4-23	6.3
4-27	5.5
4-28	19.5
4-30	43.2
4-31	3.3
4-33	54.6
4-34	18.7
4-35	10.5
4-36	13.5
4-37	8.5
4-38	3.4
4-39	10.0
4-40	9.9
4-41	12.5
4-45	3.9
4-48	8.5
4-49	3.4
4-50	3.3
4-51	3.2
4-52	8.4
4-53	4.5
4-54	36.1
4-55	11.7

4-56	30.2
4-57	10.0
4-58	3.3
4-59	22.5
4-60	38.6
4-61	6.4

[0242] 第 2 2 表 (続き)

No.	IC50
	(μ g / mL)

4-71	3.2
4-72	4.3
4-73	5.9
4-74	6.6
4-75	3.2
4-76	3.6
4-80	9.6
4-81	5.4
4-82	6.7
4-83	7.1
4-84	3.2
4-85	5.4
4-86	3.3
4-87	9.9
4-88	3.7
4-89	4.7
4-90	5.5

4-91 57.7

産業上の利用可能性

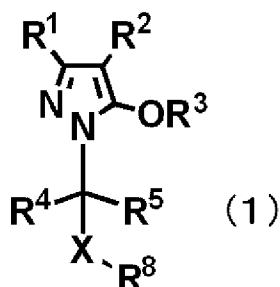
[0243] 本発明に係るピラゾール化合物は、優れた骨髓種細胞増殖阻害活性を示し、多発性骨髓腫の治療において極めて有用な化合物である。

 なお、2010年12月1日に出願された日本特許出願2010-268758号及び2011年9月30日に出願された日本特許出願2011-217818号の明細書、特許請求の範囲及び要約書の全内容をここに引用し、本発明の明細書の開示として、取り入れるものである。

請求の範囲

[請求項1] 式(1)

[化1]



[式中、 R^1 は、水素原子、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル、 R^{17} で置換された $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_{10}$ ハロアルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}$ シクロアルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_{10}$ ハロシクロアルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル、ハロゲン原子によって置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル、ハロゲン原子によって置換された $\text{C}_2 \sim \text{C}_{10}$ アルキニル、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})\text{R}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12})=\text{NR}^{13}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12})=\text{NOR}^{13}$ 、 $\text{D1} \sim \text{D23}$ 、シアノ、フェニル、 a 個の R^{11} によって置換されたフェニル、ベンジル又はベンゼン環上が a 個の R^{11} で置換されていても良いベンジルを表し、 a が2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{11} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{11} は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{N}-$ 又は $-\text{N}=\text{CHN}=\text{CH}-$ を形成することにより、2つの R^{11} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互

いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{21} は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、ハロゲン原子によって置換された $C_2 \sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、ハロゲン原子によって置換された $C_2 \sim C_{10}$ アルキニル、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{13})R^{12}$ 、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ 、 $-C(R^{12})=NOR^{13}$ 、 $D1 \sim D23$ 、ベンジル、ベンゼン環上が e 個の R^{21} で任意に置換されたベンジル、フェニル又は e 個の R^{21} で任意に置換されたフェニルを表し、 e が2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2N(R^y)-$ 、 $-CH_2N(R^y)CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2CH=CH-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-SCH=CH-$ 、 $-N(R^y)CH=CH-$ 、 $-OCH=N-$ 、 $-SCH=N-$ 、 $-N(R^y)CH=N-$ 、 $-N(R^y)N=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 、 $-OCH_2CH=CH-$ 、 $-N=CHCH=CH-$ 、 $-N=CHCH=N-$ 又は $-N=CHN=CH-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{31} は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 R^{31} によって任意に置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 R^{31} によって任意に置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{12})R^{13}$ 、 $-Si(R^{32})(R^{33})R^{34}$ 、ベンジル又はベンゼン環上が g 個の R^{15} で置換されていてもよいベンジルを表し、 g が2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

X は、単結合又は $-(CR^6R^7)_n-$ を表し、

R^4 及び R^5 は、各々独立して $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表し、さらに R^4 と R^5 が $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 又は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ を形成することにより R^4 と R^5 がそれぞれ結合する炭素原子と共に 3 員環、4 員環、5 員環又は 6 員環を形成してもよく、

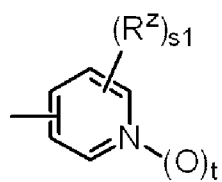
R^6 及び R^7 は、各々独立して水素原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表し、

R^8 は、D1～D23、E1～E8、M1～M9、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、F1、F2、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルケニル、フェニル又は k 個の R^{81} で任意に置換されたフェニルを表し、 k が 2 以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

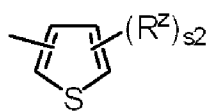
さらに、2 つの R^{81} が隣接する場合には、隣接する 2 つの R^{81} は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{N}-$ 又は $-\text{N}=\text{CHN}=\text{CH}-$ を形成することにより、2 つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に 5 員環又は 6 員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に 2 個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

D1～D23 は、それぞれ下記の構造式で表される芳香族複素環を表し、

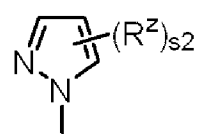
[化2]



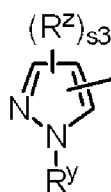
D1



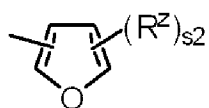
D2



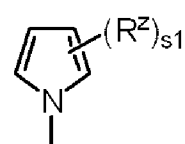
D3



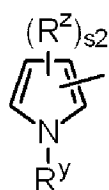
D4



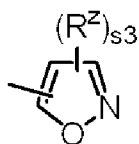
D5



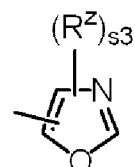
D6



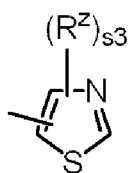
D7



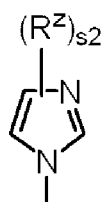
D8



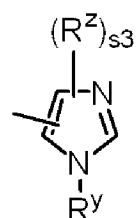
D9



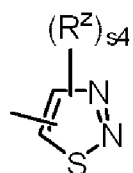
D10



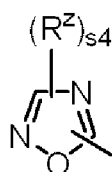
D11



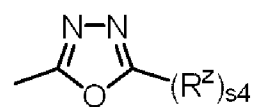
D12



D13

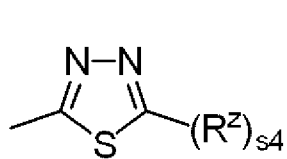


D14

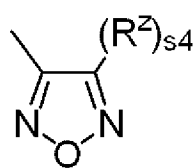


D15

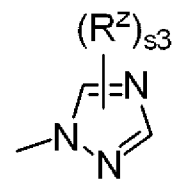
[化3]



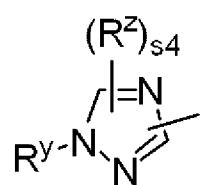
D16



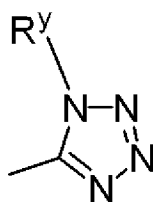
D17



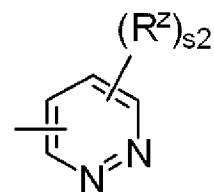
D18



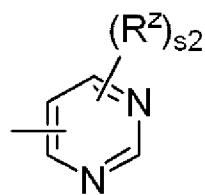
D19



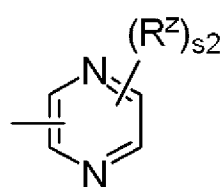
D20



D21



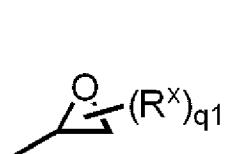
D22



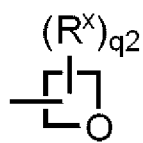
D23

E1～E8は、それぞれ下記の構造式で表される飽和複素環を表し、

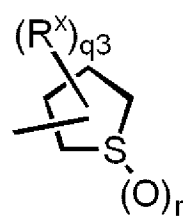
[化4]



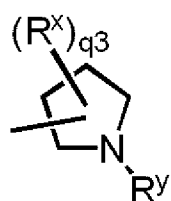
E1



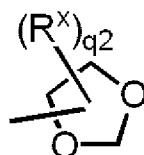
E2



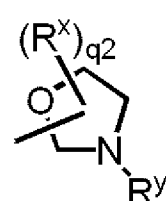
E3



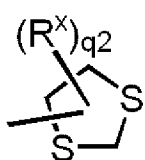
E4



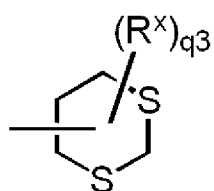
E5



E6



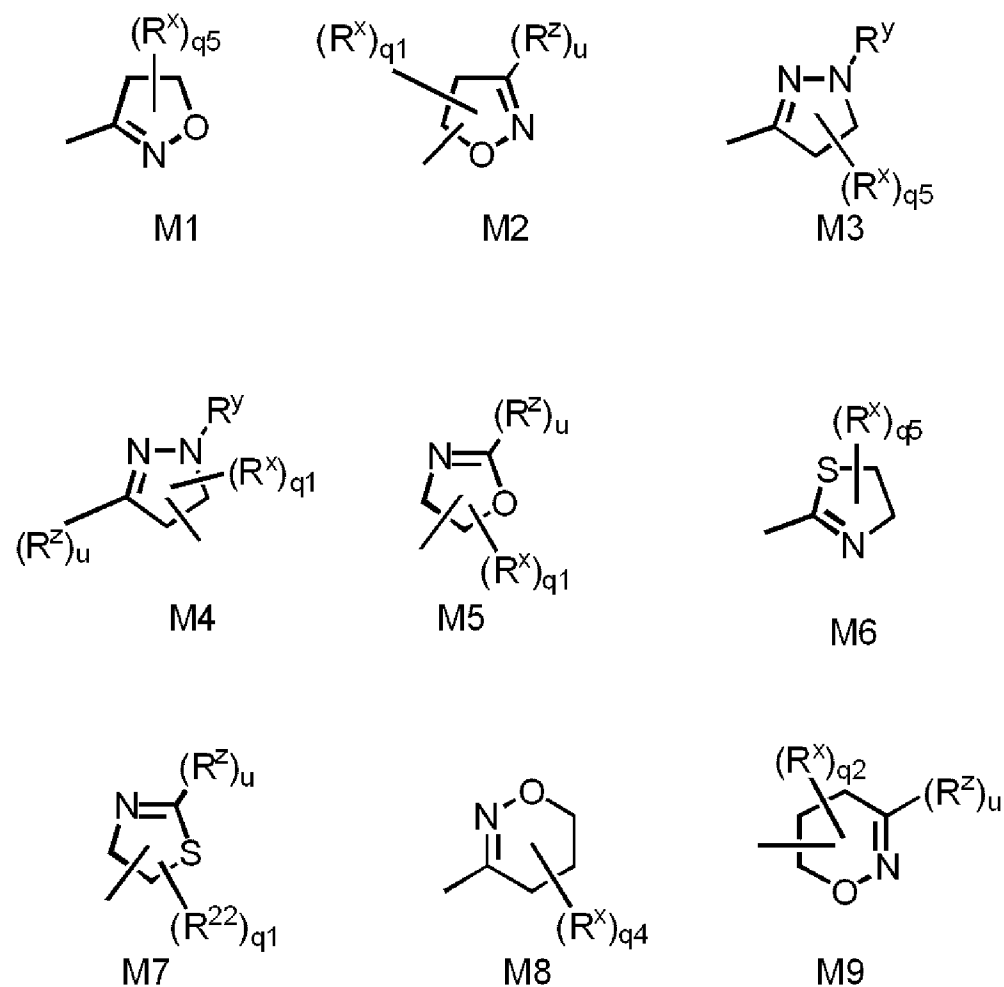
E7



E8

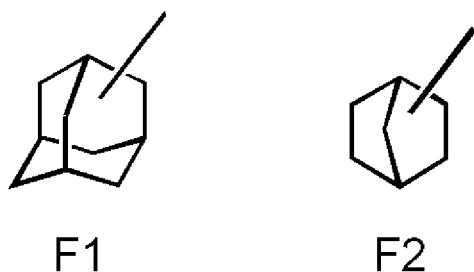
M1～M9は、それぞれ下記の構造式で表される部分不飽和芳香族複素環を表し、

[化5]



F1～F2は、それぞれ下記の構造式で表される環を表し、

[化6]



R^x は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $-OR^{82}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、フェニル、 d 個の R^{15} で置換されていても良いフェニル、ベンジル又はベンゼン環上が d 個の R^{15} で置換されていても良いベンジルを表し、 d が2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又

は互いに相異なっているとしてもよく、

R^y は、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、フェニル、 d 個の R^{15} で置換されているフェニル、ベンジル又はベンゼン環上が d 個の R^{15} で置換されているベンジルを表し、 d が2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、

R^z は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルコキシ、アルキルスルホニルオキシ、ハロアルキルスルホニルオキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(S)NH_2$ 、 $-S(O)_2NH_2$ 、フェノキシ、フェニル又は m 個の R^{16} で置換されているフェニルを表し、 m が2以上の整数を表すとき、各々の R^{16} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、 s_1 、 s_2 又は s_3 が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、

さらに、2つの R^z が隣接する場合には、隣接する2つの R^z は $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2N(R^y)-$ 、 $-CH_2N(R^y)CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2CH=CH-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-SCH=CH-$ 、 $-N(R^y)CH=CH-$ 、 $-OCH=N-$ 、 $-SCH=N-$ 、 $-N(R^y)CH=N-$ 、 $-N(R^y)N=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 、 $-OCH_2CH=CH-$ 、 $-N=CHCH=CH-$ 、 $-N=CHCH=N-$ 又は $-N=CHN=CH-$ を形成することにより、2つの R^z のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されているとしてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、

R^{11} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$

ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルコキシ、ニトロ、シアノ又はフェニルを表し、 R^{12} 及び R^{13} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、D1～D23、ベンジル、ベンゼン環上がb個の R^{14} で任意に置換されていても良いベンジル、フェニル又はb個の R^{14} で任意に置換されていても良いフェニルを表し、bが2以上の整数を表すとき、各々の R^{14} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{14} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{14} は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)-$ 、 $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{SCH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^y)\text{N}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{N}-$ 又は $-\text{N}=\text{CHN}=\text{CH}-$ を形成することにより、2つの R^{14} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{14} は、ハロゲン原子、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルコキシ、フェノキシ又はフェニルを表し、

R^{15} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルコキシ、ニトロ、シアノ又はフェニルを表し、

R^{16} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルコキシ、ニトロ、シアノ又はフェニルを表し、さらに2つの R^{16} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{16} は $-OCH_2O-$ を形成することにより、2つの R^{16} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環を形成してもよく、

R^{17} は、 $-C(O)OR^{12}$ 、フェニル又はa個の R^{11} によって置換されたフェニルを表し、aが2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{21} は、ハロゲン原子、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $-OR^{23}$ 、 $-C(O)R^{24}$ 、 $-C(O)OR^{24}$ 、 $-NR^{24}R^{25}$ 、 $-C(O)NR^{24}R^{25}$ 、 $-S(O)_2NR^{24}R^{25}$ 、フェニル又はf個の R^{22} で置換されていても良いフェニルを表し、fが2以上の整数を表すとき、各々の R^{22} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つの R^{22} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{22} は $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2N(R^y)-$ 、 $-CH_2N(R^y)CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2OCH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2CH=CH-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-SCH=CH-$ 、 $-N(R^y)CH=CH-$ 、 $-OCH=N-$ 、 $-SCH=N-$ 、 $-N(R^y)CH=N-$ 、 $-N(R^y)N=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 、 $-OCH_2CH=CH-$ 、 $-N=CHCH=CH-$ 、 $-N=CHCH=N-$ 又は $-N=CHN=CH-$ を形成することにより、2つの R^{22} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{22} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$

ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルコキシ、ニトロ、シアノ又はフェニルを表し、

R^{23} は、水素原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、フェニル、 f 個の R^{22} で置換されていても良いフェニル、ベンジル又はベンゼン環上が f 個の R^{22} で置換されていても良いベンジルを表し、 f が2以上の整数を表すとき、各々の R^{22} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{24} 及び R^{25} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、ベンジル、ベンゼン環上が b 個の R^{14} で任意に置換されていても良いベンジル、1-フェネチル、ベンゼン環上が b 個の R^{14} で任意に置換されていても良い1-フェネチル、2-フェネチル、ベンゼン環上が b 個の R^{14} で任意に置換されていても良い2-フェネチル、フェニル又は b 個の R^{14} で任意に置換されていても良いフェニルを表し、 b が2以上の整数を表すとき、各々の R^{14} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{31} は、ハロゲン原子又はフェニルを表し、

R^{32} 、 R^{33} 及び R^{34} は、各々独立して $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、ベンジル、ベンゼン環上が b 個の R^{14} で任意に置換されていても良いベンジル、フェニル又は b 個の R^{14} で任意に置換されていても良いフェニルを表し、 b が2以上の整数を表すとき、各々の R^{14} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{81} は、ハロゲン原子、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_{10}$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $-OR^{23}$ 、 $-C(R^{83})=NR^{84}$ 、 $-C(R^{83})=NOR^{84}$ 、 $-C(O)R^{24}$ 、 $-C(O)OR^{24}$ 、 $-S(O)cR^{24}$ 、 $-OS(O)_2R^{24}$ 、 $-NR^{24}R^{25}$ 、 $-$

$C(0)NR^{24}R^{25}$ 、 $-C(S)NH_2$ 、 $-S(0)_2NR^{24}R^{25}$ 、フェニル又は m 個の R^{22} で置換されていても良いフェニルを表し、 m が2以上の整数を表すとき、各々の R^{22} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{82} は、水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ ($C_1\sim C_6$)アルキル、フェニル、 d 個の R^{15} で置換されていても良いフェニル、ベンジル又はベンゼン環上が d 個の R^{15} で置換されていても良いベンジルを表し、 d が2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{83} 及び R^{84} は、各々独立して水素原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルキル、フェニル、 d 個の R^{15} で置換されていても良いフェニル、ベンジル又はベンゼン環上が d 個の R^{15} で置換されていても良いベンジルを表し、 d が2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

Z は、ハロゲン原子、シアノ、ニトロ、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルコキシ、アルキルスルホニルオキシ、ハロアルキルスルホニルオキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、 $-C(0)NH_2$ 、 $-C(S)NH_2$ 、又は $-S(0)_2NH_2$ を表し、

a, b, d, e, f, g, k 及び m は1～5の整数を表し、

c は0～2の整数を表し

q_1 は0～3の整数を表し、

q_2 は0～5の整数を表し、

q_3 は0～7の整数を表し、

q_4 は0～6の整数を表し、

q_5 は0～4の整数を表し、

r は0～2の整数を表し、
 s_1 は0～4の整数を表し、
 s_2 は0～3の整数を表し、
 s_3 は0～2の整数を表し、
 s_4 は0又は1の整数を表し、
 n は1の整数を表し、
 t は0又は1の整数を表し、
 u は0又は1の整数を表す。]

で表されるピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[請求項2] X は $-(CR^6R^7)_n-$ を表す請求項1記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[請求項3] R^1 は、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 R^{17} で置換された $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{13})R^{12}$ 、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ 、 $-C(R^{12})=NOR^{13}$ 、 $D_1 \sim D_{12}$ 、 D_{18} 、 D_{19} 、 $D_{21} \sim D_{23}$ 、フェニル又は a 個の R^{11} によって置換されたフェニルを表し、 a が2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{11} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{11} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 又は $-N=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{11} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^2 は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 D_1 、 D_2 、 $D_4 \sim D_{12}$ 、 D_{18} 、 D_{19} 、 $D_{21} \sim D_{23}$ 、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)O$

R^{12} 、ベンジル、ベンゼン環上が e 個の R^{21} で任意に置換されたベンジル、フェニル又は e 個の R^{21} で任意に置換されたフェニルを表し、 e が2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、

さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、

R^3 は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{12})R^{13}$ 、 $-Si(R^{32})(R^{33})R^{34}$ 、ベンジル又はベンゼン環上が g 個の R^{15} で置換されていてもよいベンジルを表し、 g が2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく、

R^4 及び R^5 は、各々独立して $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し

R^6 及び R^7 は、水素原子を表し

R^8 は、 $D1$ 、 $D2$ 、 $D4$ 、 $D5$ 、 $D7 \sim D12$ 、 $D19$ 、 $D22$ 、 $D23$ 、 $E1 \sim E8$ 、 $F1$ 、 $F2$ 、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、フェニル又は k 個の R^{81} で任意に置換されたフェニルを表し、 k が2以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているとしてもよく

さらに、2つの R^{81} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{81} は $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 又は $-N=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z

は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^x は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又はフェニルを表し、

R^y は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、フェニル又はd個の R^{15} で置換されていても良いフェニルを表し、dが2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^z は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェノキシ、フェニル又はm個の R^{16} で置換されていても良いフェニルを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々の R^{16} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、s1、s2又はs3が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{11} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルコキシ、ニトロ又はフェニルを表し、

R^{12} 及び R^{13} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、D2、D4、D5、D7、D21、D22、D23、ベンジル、ベンゼン環上がb個の R^{14} で任意に置換されていても良いベンジル、フェニル又はb個の R^{14} で任意に置換されていても良いフェニルを表し、bが2以上の整数を表すとき、各々の R^{14} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{14} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{14} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 又は $-N=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{14} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さ

らに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{14} は、ハロゲン原子、ニトロ、シアノ、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、フェノキシ又はフェニルを表し、

R^{15} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ又は $C_1\sim C_6$ ハロアルキルを表し、

R^{16} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_1\sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルキル又は $C_1\sim C_{10}$ ハロアルコキシを表し、さらに、2つの R^{16} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{16} は $-OCH_2O-$ を形成することにより、2つの R^{16} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環を形成してもよく、

R^{21} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_3\sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_1\sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ ($C_1\sim C_6$) アルコキシ、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、フェノキシ、フェニル又はf個の R^{22} で置換されていても良いフェニルを表し、fが2以上の整数を表すとき、各々の R^{22} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{22} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_1\sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1\sim C_{10}$ ハロアルキル又は $C_1\sim C_{10}$ ハロアルコキシを表し、さらに、2つの R^{22} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{22} は $-OCH_2O-$ を形成することにより、2つの R^{22} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環を形成してもよく、

R^{32} 、 R^{33} 及び R^{34} は、各々独立して $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、ベンジル、ベンゼン環上がb個の R^{14} で任意に置換されていても良いベンジル、フェニル又はb個の R^{14} で任意に置換されていても良いフェニルを表し、bが2以上の整数を表すとき、各々の R^{14} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{81} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ ($C_1\sim C_6$) アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ ($C_1\sim C_6$) アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、ニトロ又はシアノを表し、

Zは、ハロゲン原子又は $C_1\sim C_6$ アルキルを表す請求項2記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[請求項4]

R^{11} は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^{17} で置換された $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、D2、D4、D5、D7、D21~D23、フェニル又はa個の R^{11} によって置換されたフェニルを表し、aが2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{11} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{11} は $-CH=CHC(H)=CH-$ を形成することにより、2つの R^{11} のそれぞれが結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{21} は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、D2、D7、ベンジル、ベンゼン環上がe個の R^{21} で任意に置換されたベンジル、フェニル又はe個の R^{21} で任意に置換されたフェニルを表し、eが2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原

子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なっている場合、

R^3 は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{12})R^{13}$ 、 $-Si(R^{32})(R^{33})R^{34}$ 又はベンジルを表し、

R^8 は、D2、D7、D23、F1、F2、フェニル又はk個の R^{81} で任意に置換されたフェニルを表し、kが2以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同一であっても又は互いに相異なっている場合、さらに、2つの R^{81} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{81} は $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なっている場合、

R^y は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又はフェニルを表し、

R^z は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェノキシ、フェニル又はm個の R^{16} で置換されていても良いフェニルを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々の R^{16} は互いに同一であっても又は互いに相異なっている場合、s2又はs3が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なっている場合、

R^{12} 及び R^{13} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表し、

R^{16} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシを表し、

R^{17} は $-C(O)OR^{12}$ 又はフェニルを表し、

R^{22} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハ

ロアルキル又は $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシを表し、

R^{32} 、 R^{33} 及び R^{34} は、各々独立して $C_1\sim C_6$ アルキル又は $C_3\sim C_6$ シクロアルキルを表し、 R^{81} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルコキシ、 $C_1\sim C_2$ アルコキシ ($C_1\sim C_2$) アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルキル、フェニル又はフェノキシを表す請求項3記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[請求項5]

R^1 は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^{17} で置換された $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、フェニル又はa個の R^{11} によって置換されたフェニルを表し、aが2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^2 は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、D2、ベンジル、ベンゼン環上がe個の R^{21} で任意に置換されたベンジル、フェニル又はe個の R^{21} で任意に置換されたフェニルを表し、eが2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^3 は、水素原子を表し、

R^8 は、D2、F1、F2、フェニル、又はk個の R^{81} で任意に置換されたフェニルを表し、kが2以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同

一であっても又は互いに相異なってもよく、
 さらに、2つの R^{81} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{81} は $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^z は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、フェノキシ又はフェニルを表し、s2が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、 R^{11} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ又はニトロを表し、

R^{12} は、 $C_1\sim C_6$ アルキルを表し、

R^{17} は $-C(O)OR^{12}$ 又はフェニルを表し、

R^{21} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_2$ アルコキシ ($C_1\sim C_2$) アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、ニトロ、シアノ又はフェニルを表し、

R^{81} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、フェニル又はフェノキシを表す請求項4記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[請求項6]

R^2 は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 R^{17} で置換された $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_3\sim C_{10}$ シクロアルキル、 $C_2\sim C_{10}$ アルケニル、ハロゲン原子によって置換された $C_2\sim C_{10}$ アルケニル、 $C_2\sim C_{10}$ アルキニル、ハロゲン原子によって置換された $C_2\sim C_{10}$ アルキニル、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(R^{12})=NR^{13}$ 、 $-C(R^{12})=NOR^{13}$ 、 $D1\sim D23$ 、ベンジル、ベンゼン環上がe個の R^{21} で任意に置換されたベンジル、フェニル又はe

個の R^{21} で任意に置換されたフェニルを表し、 e が2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているもよく、

さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$, $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$, $-\text{OCH}_2\text{O}-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$, $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)-$, $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{O}-$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{S}-$, $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{OCH}=\text{CH}-$, $-\text{SCH}=\text{CH}-$, $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{OCH}=\text{N}-$, $-\text{SCH}=\text{N}-$, $-\text{N}(\text{R}^y)\text{CH}=\text{N}-$, $-\text{N}(\text{R}^y)\text{N}=\text{CH}-$, $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$, $-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{CH}-$, $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{N}-$ 又は $-\text{N}=\text{CHN}=\text{CH}-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されているもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なっているもよく、

Xは単結合を表す請求項1記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[請求項7]

R^{11} は、 $\text{C}_1\sim\text{C}_{10}$ アルキル、 R^{17} で置換された $\text{C}_1\sim\text{C}_{10}$ アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ ハロアルキル、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ シクロアルキル、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{13})\text{R}^{12}$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{12})=\text{NOR}^{13}$ 、 $\text{D}1\sim\text{D}12$ 、 $\text{D}18$ 、 $\text{D}19$ 、 $\text{D}21\sim\text{D}23$ 、フェニル又は a 個の R^{11} によって置換されたフェニルを表し、 a が2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているもよく、

さらに、2つの R^{11} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{11} は $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{CH}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ 又は $-\text{N}=\text{CHCH}=\text{CH}-$ を形成することにより、2つの R^{11} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されているもよく、さらに

、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、D1、D2、D4～D12、D18、D19、D21～D23、ベンジル、ベンゼン環上がe個の R^{21} で任意に置換されたベンジル、フェニル又はe個の R^{21} で任意に置換されたフェニルを表し、eが2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{31} は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ($C_1 \sim C_4$)アルキル、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{12})R^{13}$ 、 $-Si(R^{32})(R^{33})R^{34}$ 、ベンジル又はベンゼン環上がg個の R^{15} で置換されていてもよいベンジルを表し、gが2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{41} 及び R^{51} は、各々独立して $C_1 \sim C_4$ アルキルを表し、

R^{81} は、D1、D2、D4、D5、D7～D12、D19、D22、D23、E1～E9、F1、F2、 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、フェニル又はk個の R^{81} で任意に置換されたフェニルを表し、kが2以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{81} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{81} は $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 又は $-N=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各

々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^x は、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル又はフェニルを表し

R^y は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、フェニル又はd個の R^{15} で置換されていても良いフェニルを表し、dが2以上の整数を表すとき、各々の R^{15} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^z は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェノキシ、フェニル又はm個の R^{16} で置換されていても良いフェニルを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々の R^{16} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、s1、s2又はs3が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{11} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_{10}$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルコキシ、ニトロ又はフェニルを表し、

R^{12} 及び R^{13} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、D2、D4、D5、D7、D21、D22、D23、ベンジル、ベンゼン環上がb個の R^{14} で任意に置換されていても良いベンジル、フェニル又はb個の R^{14} で任意に置換されていても良いフェニルを表し、bが2以上の整数を表すとき、各々の R^{14} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{14} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{14} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 、 $-CH=CHCH=CH-$ 又は $-N=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{14} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環

又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R¹⁴は、ハロゲン原子、ニトロ、シアノ、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆ハロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₁~C₆ハロアルコキシ、フェノキシ又はフェニルを表し、

R¹⁵は、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、C₁~C₆アルコキシ又はC₁~C₆ハロアルキルを表し、

R¹⁶は、ハロゲン原子、C₁~C₁₀アルキル、C₁~C₁₀アルコキシ、C₁~C₁₀ハロアルキル又はC₁~C₁₀ハロアルコキシを表し、さらに、2つのR¹⁶が隣接する場合には、隣接する2つのR¹⁶は-OCH₂O-を形成することにより、2つのR¹⁶のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環を形成してもよく、

R²¹は、ハロゲン原子、C₁~C₁₀アルキル、C₃~C₁₀シクロアルキル、C₁~C₁₀アルコキシ、C₁~C₆アルコキシ (C₁~C₆) アルコキシ、C₁~C₁₀ハロアルキル、C₁~C₁₀ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、フェノキシ、フェニル又はf個のR²²で置換されていても良いフェニルを表し、fが2以上の整数を表すとき、各々のR²²は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R²²は、ハロゲン原子、C₁~C₁₀アルキル、C₁~C₁₀アルコキシ、C₁~C₁₀ハロアルキル又はC₁~C₁₀ハロアルコキシを表し、さらに、2つのR²²が隣接する場合には、隣接する2つのR²²は-OCH₂O-を形成することにより、2つのR²²のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環を形成してもよく、

R³²、R³³及びR³⁴は、各々独立してC₁~C₆アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、ベンジル、ベンゼン環上がb個のR¹⁴で任意に置換されていても良いベンジル、フェニル又はb個のR¹⁴で任意に置換されていても良い

フェニルを表し、 b が2以上の整数を表すとき、各々の R^{14} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているもよく、

R^{81} は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ ($C_1 \sim C_6$) アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、フェニル、フェノキシ、ニトロ又はシアノを表し、

Z は、ハロゲン原子又は $C_1 \sim C_6$ アルキルを表す請求項6記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[請求項8]

R^1 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 R^{17} で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $D2$ 、 $D4$ 、 $D5$ 、 $D7$ 、 $D21$ 、 $D23$ 、フェニル又は a 個の R^{11} によって置換されたフェニルを表し、 a が2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているもよく、

さらに、2つの R^{11} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{11} は $-CH=CHC(H)=CH-$ を形成することにより、2つの R^{11} のそれぞれが結合する炭素原子と共に6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なっているもよく、

R^2 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $D2$ 、 $D7$ 、ベンジル、ベンゼン環上が e 個の R^{21} で任意に置換されたベンジル、フェニル又は e 個の R^{21} で任意に置換されたフェニルを表し、 e が2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なっているもよく、

さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-OCH=CH-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つ

の R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^3 は、水素原子、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ ($C_1 \sim C_4$) アルキル、 $-C(O)R^{12}$ 、 $-C(O)OR^{12}$ 、 $-C(O)N(R^{12})R^{13}$ 、 $-Si(R^{32})(R^{33})R^{34}$ 又はベンジルを表し、

R^8 は、D2、D7、D23、F1、F2、フェニル又はk個の R^{81} で任意に置換されたフェニルを表し、kが2以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、さらに、2つの R^{81} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{81} は $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^v は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又はフェニルを表し、

R^z は、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、フェノキシ、フェニル又はm個の R^{16} で置換されていても良いフェニルを表し、mが2以上の整数を表すとき、各々の R^{16} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、s2又はs3が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{12} 及び R^{13} は、各々独立して水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルを表し、

R^{16} はハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシを表し、

R^{17} は、 $-C(OR^{12})$ 又はフェニルを表し、

R^{22} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル又は $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシを表し、

R^{32} 、 R^{33} 及び R^{34} は、各々独立して $C_1\sim C_6$ アルキル又は $C_3\sim C_6$ シクロアルキルを表し、 R^{81} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルコキシ、 $C_1\sim C_2$ アルコキシ ($C_1\sim C_2$) アルコキシ、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3\sim C_6$ ハロシクロアルキル又はフェノキシを表す請求項7記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[請求項9]

R^1 は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 R^{17} で置換された $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3\sim C_6$ シクロアルキル、フェニル又はa個の R^{11} によって置換されたフェニルを表し、aが2以上の整数を表すとき、各々の R^{11} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^2 は、 $C_1\sim C_6$ アルキル、D2、ベンジル、ベンゼン環上がe個の R^{21} で任意に置換されたベンジル、フェニル又はe個の R^{21} で任意に置換されたフェニルを表し、eが2以上の整数を表すとき、各々の R^{21} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

さらに、2つの R^{21} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{21} は $-OCH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2O-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{21} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子はZによって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上のZで置換されている場合、各々のZは互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^3 は、水素原子を表し、

R^8 は、D2、F1、F2、フェニル又はk個の R^{81} で任意に置換されたフ

エニルを表し、 k が2以上の整数を表すとき、各々の R^{81} は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよくさらに、2つの R^{81} が隣接する場合には、隣接する2つの R^{81} は $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 又は $-CH=CHCH=CH-$ を形成することにより、2つの R^{81} のそれぞれが結合する炭素原子と共に5員環又は6員環を形成してもよく、このとき、環を形成する各々の炭素原子に結合した水素原子は Z によって任意に置換されていてもよく、さらに、同時に2個以上の Z で置換されている場合、各々の Z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^z は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、フェノキシ又はフェニルを表し、

s が2以上の整数を表すとき、各々の R^z は互いに同一であっても又は互いに相異なってもよく、

R^{11} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルコキシ又はニトロを表し、

R^{12} は、 $C_1\sim C_6$ アルキルを表し、

R^{17} は $-C(O)OR^{12}$ 又はフェニルを表し、

R^{21} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_{10}$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ、 $C_1\sim C_2$ アルコキシ ($C_1\sim C_2$) アルコキシ、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、ニトロ、シアノ又はフェニルを表し、

R^{81} は、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_6$ アルキル、 $C_1\sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1\sim C_6$ アルコキシ又はフェノキシを表す請求項8記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物。

[請求項10]

請求項1～請求項9の何れか1項に記載のピラゾール化合物、該化合物の互変異性体、それらの医薬的に許容され得る塩又はそれら化合物の溶媒和物を有効成分として含有する多発性骨髄腫の治療剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2011/077829

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

C07D231/20(2006.01)i, A61K31/415(2006.01)i, A61P35/02(2006.01)i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D231/20, A61K31/415, A61P35/02

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/REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 62-77371 A (Neos Co., Ltd.), 09 April 1987 (09.04.1987), example 4 (Family: none)	1-9
A	WO 2007/003056 A1 (MERCK FROSST CANADA LTD.), 11 January 2007 (11.01.2007), claim 9 & JP 2009-500300 A & US 2009/0093444 A1 & EP 1902031 A1 & CN 101218207 A	1-10
A	WO 2002/046184 A1 (VERTEX PHARMACEUTICALS INC.), 13 June 2002 (13.06.2002), claim 11 & JP 2004-518644 A & US 2002/0111353 A1 & EP 1343781 A1	1-10

☐

Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐

See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

“A” document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

“E” earlier application or patent but published on or after the international filing date

“L” document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

“O” document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

“P” document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

“T” later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

“X” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

“Y” document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

“&” document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

16 January, 2012 (16.01.12)

Date of mailing of the international search report

24 January, 2012 (24.01.12)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (I P C))

Int.Cl. C07D231/20 (2006.01)i, A61K31/415 (2006.01)i, A61P35/02 (2006.01)i

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (I P C))

Int.Cl. C07D231/20, A61K31/415, A61P35/02

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAplus/REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
A	JP 62-77371 A (株式会社ネオス) 1987.04.09, 実施例 4 (ファミリーなし)	1-9
A	WO 2007/003056 A1 (MERCK FROSST CANADA LTD.) 2007.01.11, Claim9 & JP 2009-500300 A & US 2009/0093444 A1 & EP 1902031 A1 & CN 101218207 A	1-10
A	WO 2002/046184 A1 (VERTEX PHARMACEUTICALS INCORPORATED) 2002.06.13, Claim11	1-10

☒ C 欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の 1 以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

1 6 . 0 1 . 2 0 1 2

国際調査報告の発送日

2 4 . 0 1 . 2 0 1 2

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (I S A / J P)

郵便番号 1 0 0 - 8 9 1 5

東京都千代田区霞が関三丁目 4 番 3 号

特許庁審査官 (権限のある職員)

植原 克典

電話番号 0 3 - 3 5 8 1 - 1 1 0 1 内線 3 4 9 2

4 P

9 8 4 0

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求項の番号
	& JP 2004-518644 A & US 2002/0111353 A1 & EP 1343781 A1	