

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2010-505762

(P2010-505762A)

(43) 公表日 平成22年2月25日(2010.2.25)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
A 6 1 K 31/496 (2006.01)	A 6 1 K 31/496	4 C O 2 2
C O 7 D 405/12 (2006.01)	C O 7 D 405/12	4 C O 6 3
A 6 1 P 43/00 (2006.01)	A 6 1 P 43/00 1 1 1	4 C O 8 6
A 6 1 P 37/06 (2006.01)	A 6 1 P 37/06	
A 6 1 P 3/10 (2006.01)	A 6 1 P 3/10	

審査請求 有 予備審査請求 未請求 (全 133 頁) 最終頁に続く

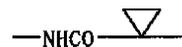
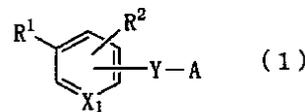
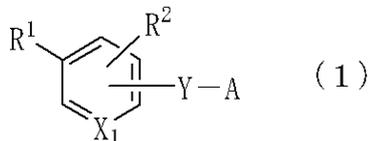
(21) 出願番号	特願2009-529959 (P2009-529959)	(71) 出願人	000206956 大塚製薬株式会社 東京都千代田区神田司町2丁目9番地
(86) (22) 出願日	平成19年10月2日 (2007.10.2)	(74) 代理人	110000855 特許業務法人浅村特許事務所
(85) 翻訳文提出日	平成21年3月31日 (2009.3.31)	(74) 代理人	100066692 弁理士 浅村 皓
(86) 国際出願番号	PCT/JP2007/069645	(74) 代理人	100072040 弁理士 浅村 肇
(87) 国際公開番号	W02008/044667	(74) 代理人	100102897 弁理士 池田 幸弘
(87) 国際公開日	平成20年4月17日 (2008.4.17)	(74) 代理人	100088926 弁理士 長沼 暉夫
(31) 優先権主張番号	特願2006-271172 (P2006-271172)	(74) 代理人	100097870 弁理士 梶原 斎子
(32) 優先日	平成18年10月2日 (2006.10.2)		
(33) 優先権主張国	日本国 (JP)		

最終頁に続く

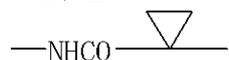
(54) 【発明の名称】 STAT3 / 5 活性化阻害剤

(57) 【要約】

本発明は、STAT3 / 5 活性化阻害剤を提供することを課題とする。本発明は、一般式



[式中、 X_1 は、窒素原子又は基 - CH = を示す。 R^1 は、基 - Z - R^6 を示す。 Z は、基 - CO -、基 - CH(OH) - 等を、 R^6 は、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を 1 ~ 4 個有する 5 ~ 15 員の単環、二項環又は三項環の飽和又は不飽和複素環基を示す。 R^2 は、水素原子又はハロゲン原子を示す。 Y は、基 - O -、基 - CO -、基 - CH(OH) -、低級アルキレン基等を示す。 A は、基



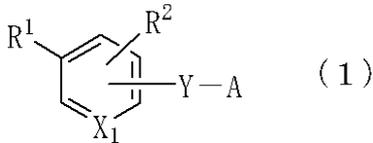
等を示す。 R^3 は水素原子、低級アルコキシ基等を、 p

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式

【化 1】

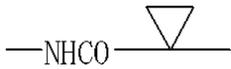


[式中、 X_1 は、窒素原子又は基 - CH = を示す。

R^1 は、基 - Z - R^6 を示す。

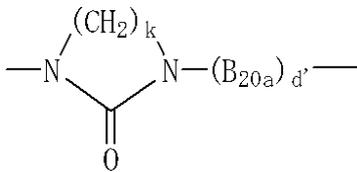
Z は、基 - N (R^8) - B - 、基 - B - N (R^8) - 、基 - B_0 - O - 、基

【化 2】



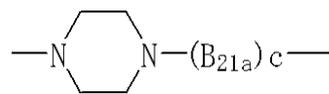
、基 - CO - 、基 - CH (OH) - 、基 - N (R^{9a}) - CO - N (R^{9b}) - 、基 - N = CH - 、基 - N (R^{10a}) - SO₂ - (B_{22a})_e - 、低級アルケニレン基、基 - NHCO - B_1 - 、基 - NHCO - B_2 - (W)_u - 、基 - B_0 - O - B_{19a} - 、基

【化 3】



、基

【化 4】



、基 - SO₂ - N (R^{10b}) - 、基 - S - 、低級アルキニレン基、低級アルキレン基、基 - N (R^8d) - 又は基 - CO - NH - B_{18a} - を示す。

R^8 は、水素原子、置換基として低級アルコキシ基を有することのある低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル低級アルキル基を示す。

B は、基 - CO - 又は低級アルキレン基を示す。

B_0 は、低級アルキレン基を示す。

B_1 は、置換基としてフェニル基を有することのある低級アルケニレン基を示す。

B_2 は、低級アルコキシ基及びフェニル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい低級アルキレン基を示す。

R^{9a} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

R^{9b} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

R^{10a} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

B_{22a} は、低級アルキレン基又は低級アルケニレン基を示す。

e は、0 又は 1 を示す

B_{18a} は、低級アルキレン基を示す。

B_{19a} は、低級アルキレン基を示す。

B_{20a} は、低級アルキレン基を示す。

B_{21a} は、低級アルキレン基を示す。

k は、2 又は 3 を示す。

c は 0 又は 1 を示す。

d' は 0 又は 1 を示す。

R^{10b} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

10

20

30

40

50

R^8 は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

Wは、酸素原子、基 - NH - 又は硫黄原子を示す。

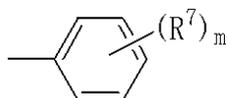
uは、0又は1を示す。

R^6 は、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する5～15員の単環、二項環又は三項環の飽和又は不飽和複素環基（該複素環上には、オキソ基；置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基；置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基；ハロゲン原子；低級アルキルスルホニル基；フェニル環上にハロゲン原子を有することのある低級アルキル基が置換していてもよいフェニル基；低級アルキルチオ基；ピロリル基；ベンゾイル基；低級アルカノイル基；低級アルコキシカルボニル基；並びに置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい）、アダマンチル基、ナフチル基（ナフタレン環上に低級アルキル基、ハロゲン原子並びに置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい）、置換基として低級アルコキシ基を有することのあるアルキル基、シクロアルキル環上に低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよいシクロアルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルケニル基、低級アルカノイル基、ベンゾイル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及びハロゲン原子なる群から選ばれた基が1～3個有していてもよい）、ハロゲン原子置換低級アルキル基、シクロアルキル低級アルキル基又は基

10

20

【化5】



を示す。

R^7 は、水素原子、フェニル基、カルボキシ基、水酸基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、フェノキシ基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、低級アルキレンジオキシ基、置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、ベンゾイル基及びシクロアルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基、シアノ基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、アミノスルホニル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイルオキシ基、低級アルコキシカルボニル低級アルキル基或いは窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する5～6員の飽和又は不飽和複素環基（該複素環上にはオキソ基が置換していてもよい）を示す。

30

mは、1～5の整数を示す。mが2～5を示す場合、2～5個の R^7 は、同一であってもよいし、異なってもよい。

R^2 は、水素原子、ハロゲン原子又は低級アルキル基を示す。

Yは、基 - O -、基 - N(R^5) -、基 - CO -、基 - CH(OH) -、低級アルキレン基、基 - S(O) n - 又は基 - C(=N-OH) - を示す。

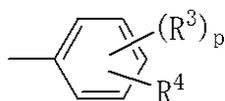
40

R^5 は、水素原子、低級アルキル基、低級アルカノイル基、ベンゾイル基、フェニル低級アルキル基又はシクロアルキル基を示す。

nは、0、1又は2を示す。

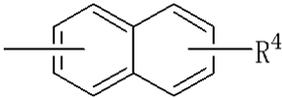
Aは、基

【化6】



又は基

【化 7】



を示す。

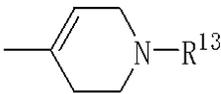
p は、1 又は 2 を示す。

R³ は、水素原子、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、基 - CONR¹¹R¹² 又はシアノ基を示す。

R¹¹ 及び R¹² は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、シクロアルキル基又はフェニル基を示す。また、R¹¹ と R¹² とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、硫黄原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して 5 ~ 7 員の飽和複素環を形成してもよい。

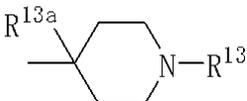
R⁴ は、イミダゾリル低級アルキル基、1, 2, 4 - トリアゾリル低級アルキル基、1, 2, 3 - トリアゾリル低級アルキル基、1, 2, 5 - トリアゾリル低級アルキル基、ピラゾリル低級アルキル基、ピリミジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピリミジニル低級アルキル基、3, 5 - ジオキソイソキサゾリジン - 4 - イリデン低級アルキル基、1, 2, 4 - オキサジアゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのある 1, 2, 4 - オキサジアゾリル低級アルキル基、チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニル低級アルキル基、基

【化 8】



、基

【化 9】



又は基 - (T)₁ - N(R¹⁴)R¹⁵ を示す。

R¹³ は、水素原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基、イミダゾリル低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、カルボキシ低級アルキル基、ベンゾイル基、モルホリノ置換低級アルカノイル基、フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基がピペラジン環上に置換していてもよいピペラジニルカルボニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基がピペラジン環上に置換していてもよいピペラジニル低級アルカノイル基、モルホリノカルボニル置換低級アルキル基又はイミダゾリル低級アルカノイル基を示す。

R^{13a} は、水素原子又は水酸基を示す。

T は、低級アルキレン基、基 - N(R¹⁷) - B₃ - CO - 、基 - B₁₉ - N(R¹⁸) - CO - 、基 - B₄ - CO - 、基 - Q - B₅ - CO - 、基 - B₆ - N(R¹⁹) - B₇ - CO - 、基 - CO - B₈ - 、基 - CH(OH) - B₉ - 、基 - CO - B₁₀ - CO - 、基 - CH(OH) - B₁₁ - CO - 、基 - CO - 、基 - SO₂ - 又は基 - B_{23a} - CO - CO - を示す。

R¹⁷ は、水素原子、低級アルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキルカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基、低級アルケニル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイル基又は低

級アルキルスルホニル基を示す。

B₃ は、低級アルキレン基を示す。

B₁₉ は、低級アルキレン基を示す。

R¹⁸ は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

B₄ は、低級アルケニレン基又は置換基として水酸基を有することのある低級アルキレン基を示す。

Q は、酸素原子又は基 - S (O) n - (n は前記に同じ) を示す。

B₅ は、低級アルキレン基を示す。

B₆ は、低級アルキレン基を示す。

R¹⁹ は、水素原子又は低級アルカノイル基を示す。

B₇ は、低級アルキレン基を示す。

B₈ は、低級アルキレン基を示す。

B₉ は、低級アルキレン基を示す。

B₁₀ は、低級アルキレン基を示す。

B₁₁ は、低級アルキレン基を示す。

B_{23a} は、低級アルキレン基を示す。

l は、0 又は 1 を示す。

R¹⁴ は、水素原子又は置換基として水酸基を有することのあるアルキル基を示す。R¹

⁵ は、(2)水酸基置換アルキル基、(3)置換基として水酸基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるシクロアルキル基、(4)フェノキシ低級アルキル基、(5)フェ

ニル環上に低級アルキル基；置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基；ハロゲン原子；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ低級アル

コキシ基；水酸基置換低級アルキル基；フェニル低級アルキル基；低級アルキニル基；置換基として低級アルキルスルホニル基を有することのあるアミノ基；低級アルキルチオ基

；シクロアルキル基；フェニルチオ基；アダマンチル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるアニリノ基；低級アルコキシカルボニル基；ピペラジン環

上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペラジニル基；ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニル基；低級アルカノイルアミノ基；

シアノ基；及びフェノキシ基なる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよいフェニル基、(6)フェノキシ基、(7)フェニル環上にハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を

有することのある低級アルコキシ基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよいフェニル低級アルキル基、(8)フェニル環上に置換基として低級

アルキレンジオキシ基を有するフェニル低級アルキル基、(10)低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基、(11)カルボキシ置換低級アルキル基、(12)置換基として低級アルカ

ノイル基を有することのあるアミノ基、(13)テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキソ基、低級アルコキシ基及び低級アルキレンジオキシ基なる群から選ばれた基を 1 ~ 3

個有することのある 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル基、(14)シクロアルキル低級アルキル基、(15)フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基がピペラジン環上に置換していてもよいピペラジニル低級アル

カノイル基、(16)ピリジル低級アルキル基、(17)置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基置換低級アルキル

基、(18)低級アルコキシ低級アルキル基、(19)イミダゾリル基、(20)イミダゾリル低級アルキル基、(21) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリルカルボニル置換低級アルキル

基、(22)ピペリジン環上に置換基として低級アルコキシカルボニル基、フェニル低級アルキル基及びフリル低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピペリジニル

カルボニル基、(23)チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニル低級アルカノイル基、(24)ピペリジン環上に低級アルコキシカルボニル基、フェニル低級アルキル基、低級アルキル基、ベンゾイル基及びフリル低級アルキル基からなる

群から選ばれた基が置換していてもよいピペリジニル基、(25)基

群から選ばれた基が置換していてもよいピペリジニル基、(25)基

10

20

30

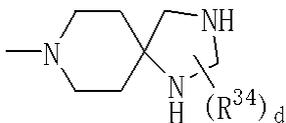
40

【化 1 0】



が置換したカルボニル低級アルキル基、(26)基

【化 1 1】



が置換したカルボニル低級アルキル基、(27)基 - CO - B₂₀ - N(R³⁶)R³⁷、(26a)ピロリジニル低級アルキル基、(27a)モルホリノ低級アルキル基、(28a)フェニル低級アルケニル基、(29a)フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノカルボニル低級アルキル基、(30a)インドリル基、(31a)ピペラジン環上に置換基として低級アルキル基及びフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有することのあるピペラジニル低級アルキル基、(32a)置換基として低級アルキル基を有することのあるアミジノ低級アルキル基、(33a)フルオレニル基、(34a)カルバゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるカルバゾリル基、(35a)置換基として低級アルキル基を有することのあるアミジノ基、(36a)ピペラジン環上に置換基としてフェニル低級アルキル基(フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基及び低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を1~3個有していてもよい)及びピリジル低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1~3個有することのあるピペラジニル置換オキサリル基、又は(37a)シアノ置換低級アルキル基を示す。

R³⁴は、オキソ基又はフェニル基を示す。

dは、0~3の整数を示す。

B₂₀は、低級アルキレン基を示す。

R³⁶及びR³⁷は、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成される5~7員の飽和複素環基を示す。該複素環基上には、フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基が1~3個置換していてもよい。

R¹⁴とR¹⁵とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5~10員の飽和又は不飽和複素環；或いは基

【化 1 2】



を形成してもよい。該複素環上には、(28)フェニル環上に置換基として低級アルカノイル基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基及び低級アルキレンジオキシ基なる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよいフェニル基を1~2個有し、低級アルキル基上にピリジル基を有することのあるフェニル置換低級アルキル基、

(29)カルバモイル基、(30)ピリジン環上に置換基として水酸基及び置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるピリジル低級アルキル基、(31)ピロール環上に置換基として低級アルキル基を1~3個有することのあるピロリル低級アルキル基、(32)ベンゾオキサゾリル低級アルキル基、(33)ベンゾチアゾリル低級アルキル基、(34)フリル低級アルキル基、(35)フェニル環上にシアノ基

10

20

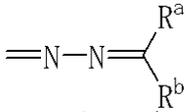
30

40

50

、置換基として低級アルキルスルホニル基を有することのあるアミノ基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニル低級アルキル基、チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニリデン低級アルキル基及び低級アルキレンジオキシ基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよいベンゾイル基、(36)ピリジニル基、(37)ピラジニル基、(38)ピリジル基、(39)低級アルコキシカルボニル基、(40)チアゾリジン環上にオキソ基及び基

【化13】



(R^a 及び R^b は、それぞれ低級アルキル基を示す。) からなる群より選ばれた基が置換していてもよいチアゾリジニル低級アルカノイル基、(41)置換基として水酸基及びハロゲン原子からなる群より選ばれた基を有することのある低級アルキル基、(42)置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基、(43)フェニル環上に低級アルコキシ低級アルキル基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有することのあるカルバモイル基、低級アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、シアノ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルキル基及び水酸基からなる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよいフェニル基、(44)フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有するフェニル基、(45)ナフチル低級アルキル基、(46)フェニル環上にシアノ基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基なる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよいフェノキシ基、(47)フェノキシ低級アルキル基、(48)フェニル環上にハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよいフェニル低級アルコキシ基、(49)基 - (B_{12}CO)t - $\text{N}(\text{R}^{20})\text{R}^{21}$ 、(50)基 - (CO)o - B_{13} - $\text{N}(\text{R}^{22})\text{R}^{23}$ 、(51)1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン環上に置換基として低級アルキル基を1～5個有していてもよい1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフチル置換低級アルキル基、(52)置換基として水酸基を有することのあるシクロアルキル基、(53)ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を1～3個有していてもよいピペリジニル基、(54)キノリル低級アルキル基、(55)テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有することのある1, 2, 3, 4 - テトラゾリル低級アルキル基、(56)チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリル低級アルキル基、(57)フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基及びハロゲン原子からなる群から選ばれる基を1～3個有することのあるベンゾイル低級アルキル基、(58)ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニル低級アルキル基、(59)イミダゾール環上に置換基としてフェニル基を1～3個有することのあるイミダゾリル基、(60)ベンズイミダゾール環上に置換基として低級アルキル基を1～3個有することのあるベンズイミダゾリル基、(61)ピリジル低級アルコキシ基、(62)テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキソ基を有することのある1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル低級アルキル基、(63)1, 3, 4 - オキサジアゾール環上に置換基としてオキソ基を有することのある1, 3, 4 - オキサジアゾリル低級アルキル基、(64)シクロアルキル低級アルキル基、(65)テトラヒドロピラニル基、(66)チエニル低級アルキル基、(67)ピリミジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピリミジニルカルボニル基、(68)水酸基、(69)カルボキシ基、(70)低級アルコキシ低級アルキル基、(71)低級アルコキシ低級アルコキシ基、(72)ベンゾイルオキシ基、(73)低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基、(74)カルボキシ低級ア

10

20

30

40

50

ルコキシ基、(75)フェノキシ低級アルカノイル基、(76)テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキシ基を有することのある1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリルカルボニル基、(77)フェニルスルホニル基、(78)イミダゾリル低級アルカノイル基、(79)イミダゾリル低級アルキル基、(80)ピリジルカルボニル基、(81)イミダゾリルカルボニル基、(82)低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、(83)カルボキシ低級アルキル基、(84)基 - (O - B₁₅)s - CO - N(R²⁶)R²⁷、(85)基 - N(R²⁸) - CO - B₁₆ - N(R²⁹)R³⁰、(86)基 - N(R³¹) - B₁₇ - CO - N(R³²)R³³、(87)ベンゾオキサゾリル基、(88a)ベンゾチエニル基、(89a)オキシ基、及び(90a)テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキシ基を有することのある1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基からなる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよい。

10

B₁₂は、低級アルキレン基を示す。

tは、0又は1を示す。

R²⁰及びR²¹は、同一又は異なって、水素原子；置換基として低級アルコキシカルボニル基を有することのあるアミノ基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を1~3個有することのあるベンゾイル基；低級アルキル基；フェニル環上に低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基及び低級アルキルチオ基からなる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよいフェニル基を1~2個有する低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよいフェニル基；低級アルコキシカルボニル基；シクロアルキル低級アルキル基；ピロリジン環上に置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基を1~3個有することのあるピロリジニル低級アルキル基；置換基としてフェニル基及び低級アルキル基からなる群から選ばれた基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基；1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上に置換基として低級アルキル基を1~5個有していてもよい1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル置換低級アルキル基；ナフチル低級アルキル基；ピリジル低級アルキル基；キノリル低級アルキル基；テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1~3個有することのある1, 2, 3, 4-テトラゾリル低級アルキル基；1, 2, 4-トリアゾリル低級アルキル基；低級アルキル基上に置換基として水酸基を有することのあるテトラヒドロフリル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びニトロ基からなる群から選ばれた基を1~3個有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル低級アルカノイル基；置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基；イミダゾリル低級アルカノイル基；低級アルコキシカルボニル低級アルキル基；ピリジル基；カルボキシ低級アルキル基又はシクロアルキル基を示す。また、R²⁰とR²¹とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5~7員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子及びハロゲン原子を有することのある低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1~3個有することのあるフェニル基並びにフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基からなる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよい。

20

30

40

oは、0又は1を示す。

B₁₃は、低級アルキレン基を示す。

R²²及びR²³は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を1~3個有することのあるベンゾイル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、フェニル低級アルキル基又はフェニル基を示す。また、R²²とR²³とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5~7員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基及びフェ

50

ニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい。

B_{15} は、低級アルキレン基を示す。

s は、0又は1を示す。

R^{26} 及び R^{27} は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、フェニル低級アルキル基又はイミダゾリル低級アルキル基を示す。また、 R^{26} と R^{27} とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基を1～3個有していてもよい。

R^{28} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

B_{16} は、低級アルキレン基を示す。

R^{29} 及び R^{30} は、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成される5～7員の飽和複素環基を示す。該複素環上には、低級アルキル基、フェニル基及びフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい。

R^{31} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

B_{17} は、低級アルキレン基を示す。

R^{32} 及び R^{33} は、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成される5～7員の飽和複素環基を示す。該複素環上には、低級アルキル基、フェニル基及びフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基からなる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい。

但し、上記化合物又はその塩は、下記(i)～(v)の要件を満たしているものとする。

(i) X_1 が基 - CH = を示すとき、 R^3 は水素原子を示す。

(ii) X_1 が基 - CH = を示し、 l が1を示し、 T が - CO - を示し、かつ R^{14} が水素原子又は置換基として水酸基を有することのあるアルキル基を示すとき、 R^{15} は基(24)を示す。

(iii) X_1 が基 - CH = を示し、 l が1を示し、かつ T が - N(R^{17}) - B_3 - CO - を示すとき、 R^{14} 及び R^{15} は、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～10員の飽和又は不飽和複素環を形成し、かつ該複素環上には、基(28)が1～3個置換されている。

(iv) X_1 が窒素原子を示しかつ l が0であるとき、又は X^1 が窒素原子を示し、 l が1であり、かつ T が - CO - もしくは - SO₂ を示すとき、 R^{15} は、基(5)、(7)、(19)及び(20)ではない。

(v) R^6 がシクロアルキル環上に低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基からなる群から選ばれた基が置換していてもよいシクロアルキル基を示すとき、 R^4 は基 - (T)₁ - N(R^{14}) R^{15} を示すものとする。(T及び l は、前記に同じ。 R^{14} 及び R^{15} は、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～10員の飽和複素環；或いは R^{14} 及び R^{15} は、基

【化14】



を形成する。)]

で表される芳香族化合物又はその塩を有効成分として含有するSTAT3/5活性化阻害

10

20

30

40

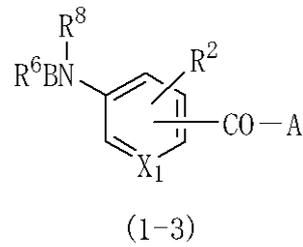
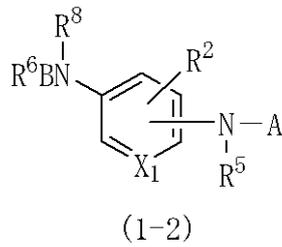
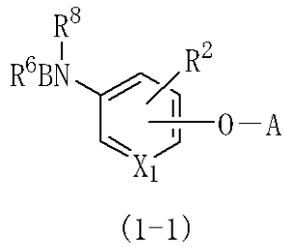
50

剤。

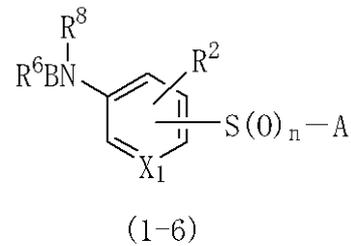
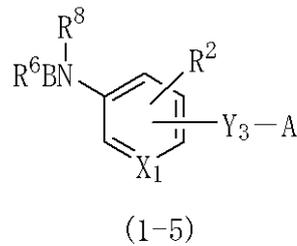
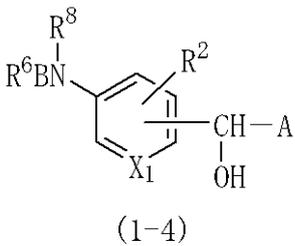
【請求項 2】

下記一般式(1-1)～一般式(1-7)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

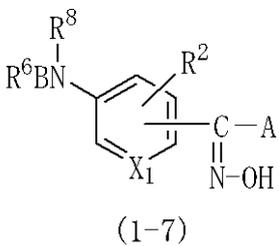
【化15】



10



20



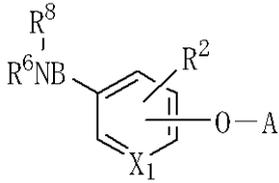
[式中、Y₃ は、低級アルキレン基を示す。]

【請求項 3】

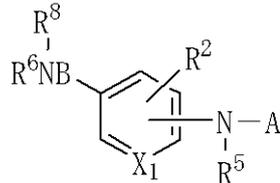
下記一般式(1-8)～一般式(1-14)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

30

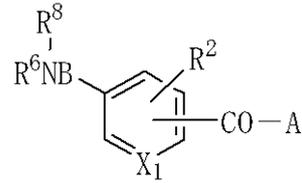
【化 1 6】



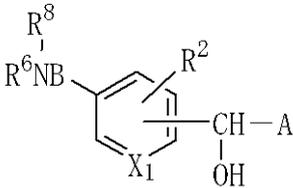
(1-8)



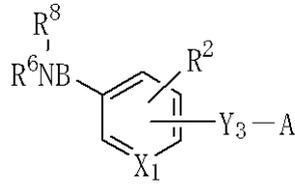
(1-9)



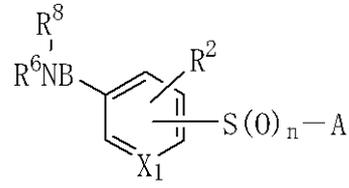
(1-10)



(1-11)

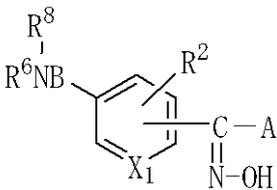


(1-12)



(1-13)

10



(1-14)

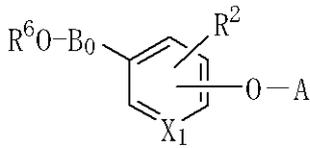
20

[式中 Y₃ は、低級アルキレン基を示す。]

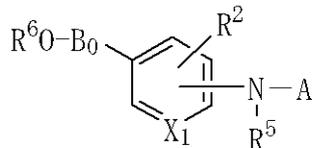
【請求項 4】

下記一般式(1-15)～一般式(1-21)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

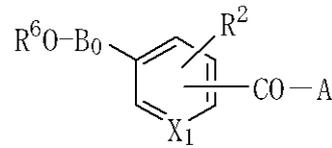
【化 1 7】



(1-15)

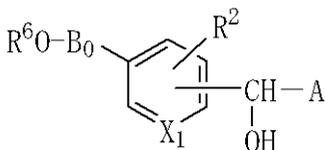


(1-16)

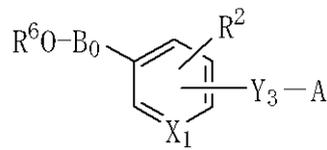


(1-17)

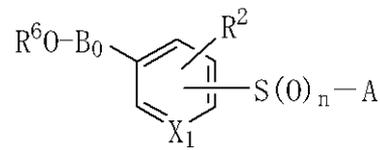
30



(1-18)

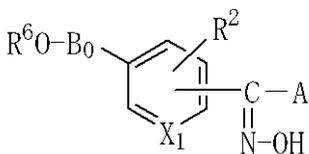


(1-19)



(1-20)

40



(1-21)

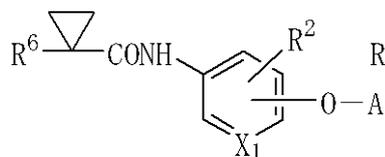
[式中、Y₃ は、低級アルキレン基を示す。]

50

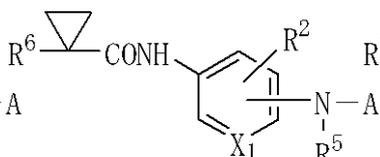
【請求項 5】

下記一般式(1-22)～一般式(1-28)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

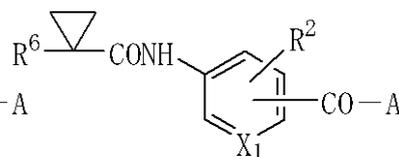
【化18】



(1-22)

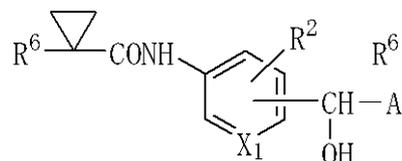


(1-23)

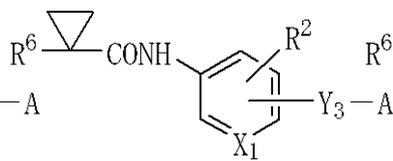


(1-24)

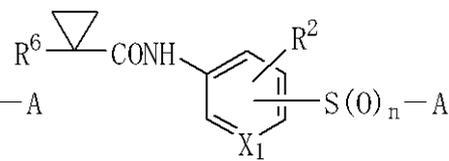
10



(1-25)

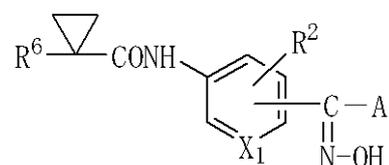


(1-26)



(1-27)

20



(1-28)

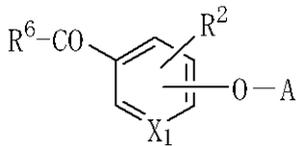
[式中、Y₃ は、低級アルキレン基を示す。]

【請求項 6】

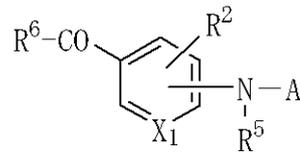
下記一般式(1-29)～一般式(1-35)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

30

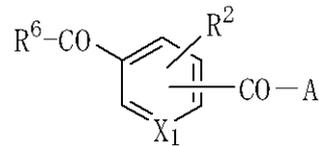
【化 1 9】



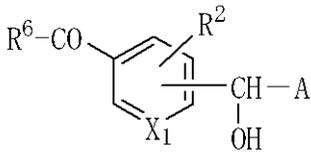
(1-29)



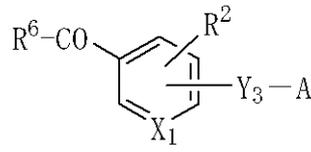
(1-30)



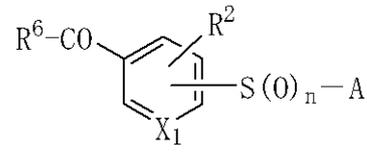
(1-31)



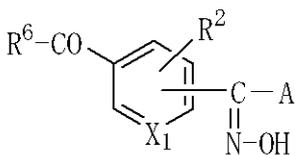
(1-32)



(1-33)



(1-34)



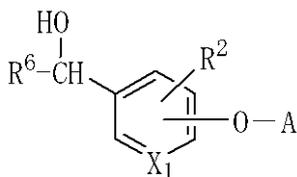
(1-35)

[式中、Y₃ は、低級アルキレン基を示す。]

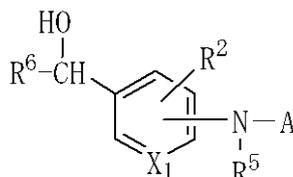
【請求項 7】

下記一般式(1-36)～一般式(1-42)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

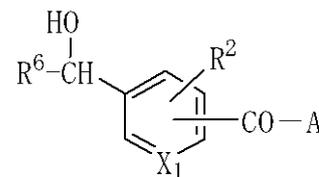
【化 2 0】



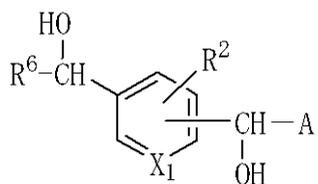
(1-36)



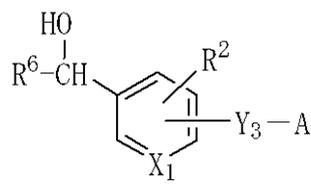
(1-37)



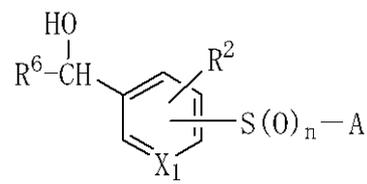
(1-38)



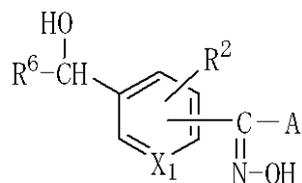
(1-39)



(1-40)



(1-41)



(1-42)

[式中、Y₃ は、低級アルキレン基を示す。]

10

20

30

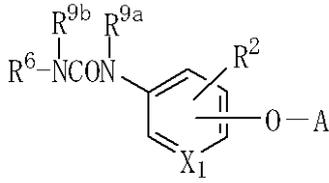
40

50

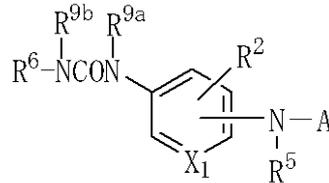
【請求項 8】

下記一般式(1-43)～一般式(1-49)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

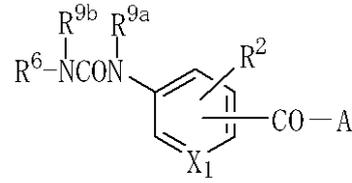
【化 2 1】



(1-43)

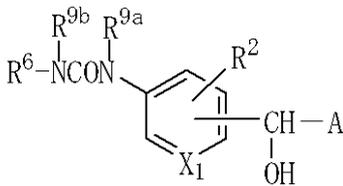


(1-44)

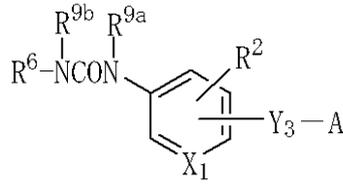


(1-45)

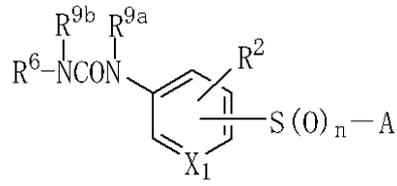
10



(1-46)

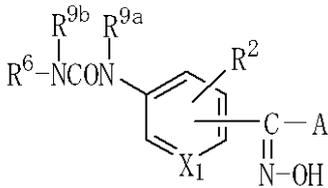


(1-47)



(1-48)

20



(1-49)

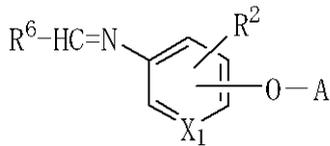
[式中、Y₃ は、低級アルキレン基を示す。]

【請求項 9】

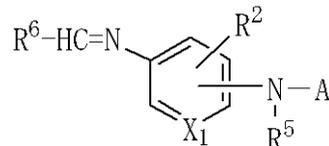
下記一般式(1-50)～一般式(1-56)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

30

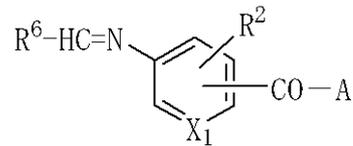
【化 2 2】



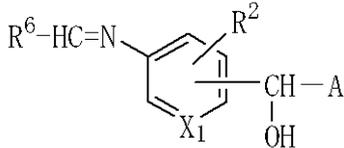
(1-50)



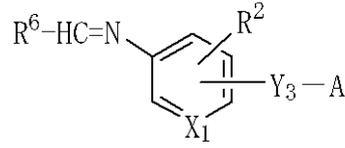
(1-51)



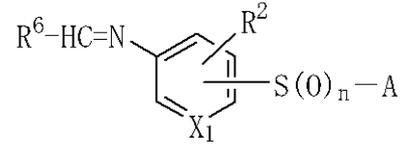
(1-52)



(1-53)

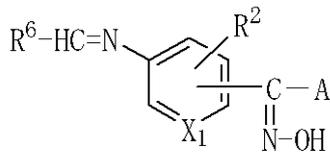


(1-54)



(1-55)

10



(1-56)

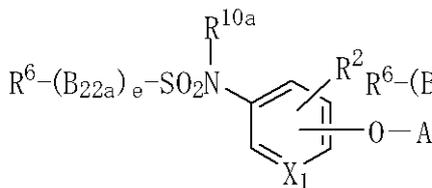
20

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

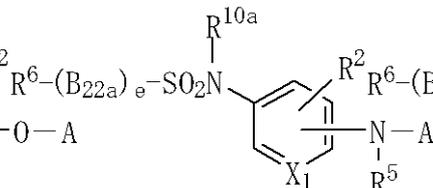
【請求項 10】

下記一般式(1-57)~一般式(1-63)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

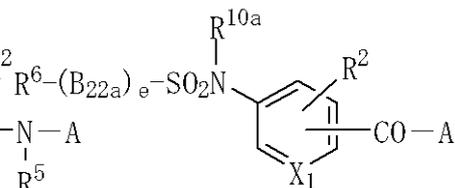
【化 2 3】



(1-57)

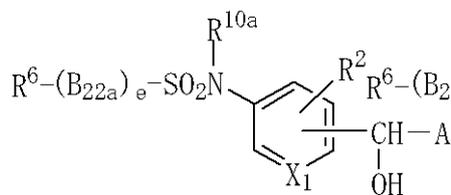


(1-58)

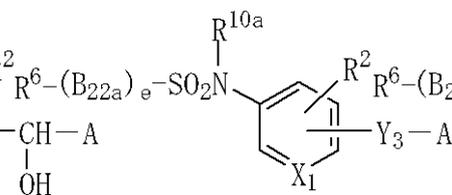


(1-59)

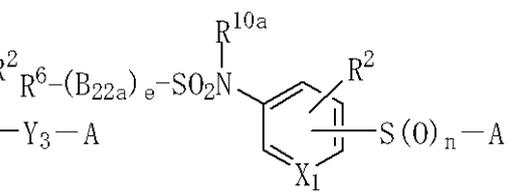
30



(1-60)

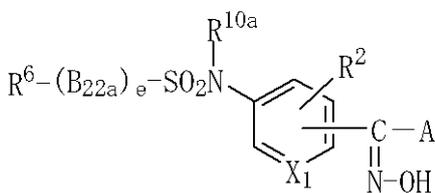


(1-61)



(1-62)

40



(1-63)

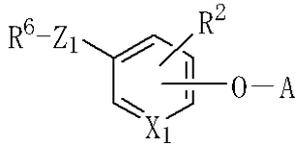
[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

50

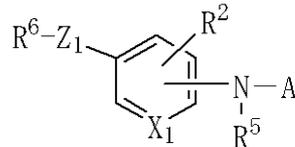
【請求項 1 1】

下記一般式(1-64)～一般式(1-70)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項 1 に記載の阻害剤。

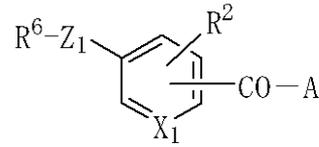
【化 2 4】



(1-64)

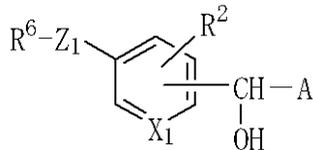


(1-65)

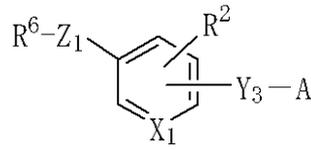


(1-66)

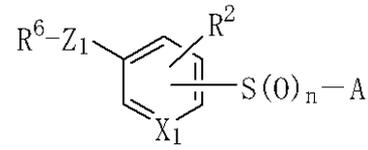
10



(1-67)

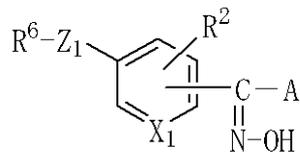


(1-68)



(1-69)

20



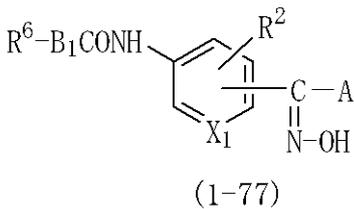
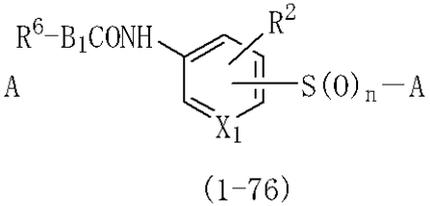
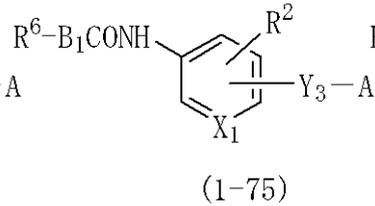
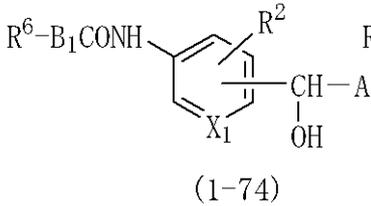
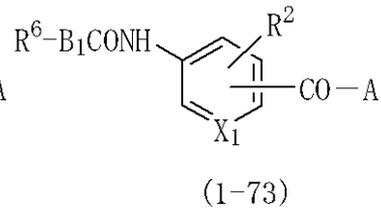
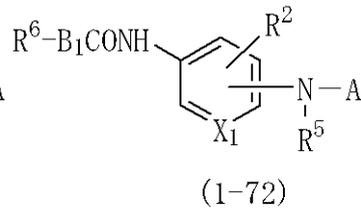
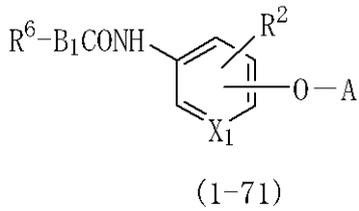
(1-70)

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示し、 Z_1 は、低級アルケニレン基を示す。]

【請求項 1 2】

下記一般式(1-71)～一般式(1-77)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項 1 に記載の阻害剤。

【化 2 5】

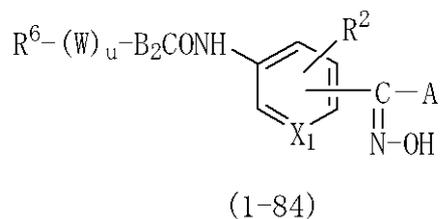
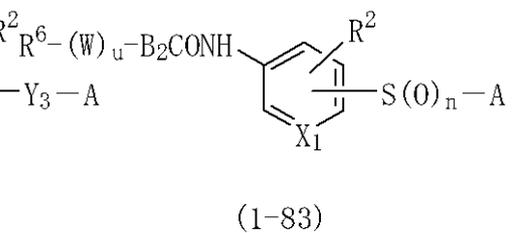
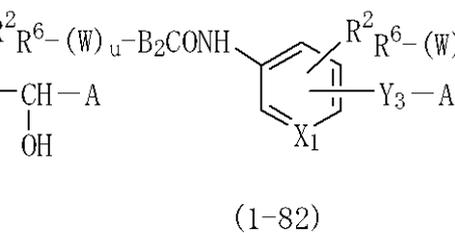
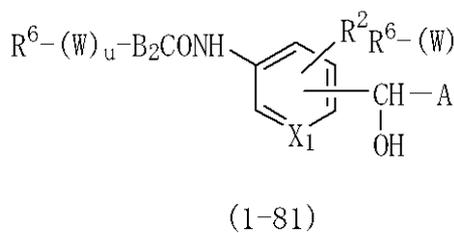
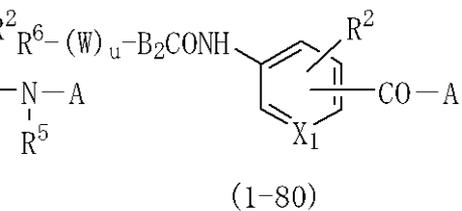
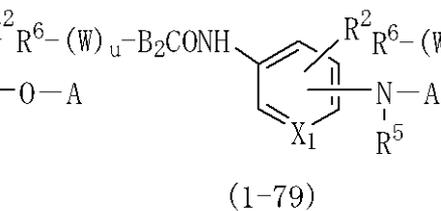
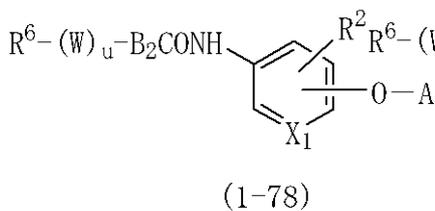


[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

【請求項 1 3】

下記一般式(1-78)~一般式(1-84)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

【化 2 6】



[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

【請求項 1 4】

10

20

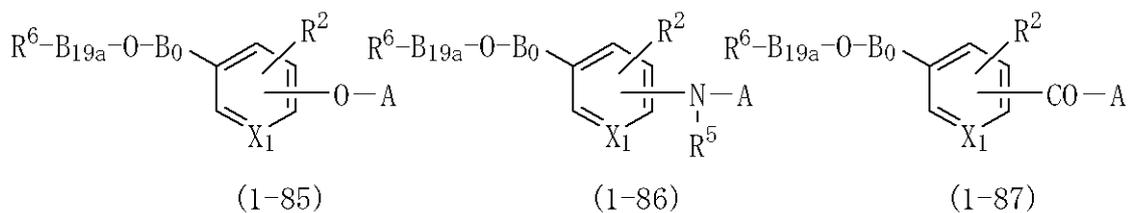
30

40

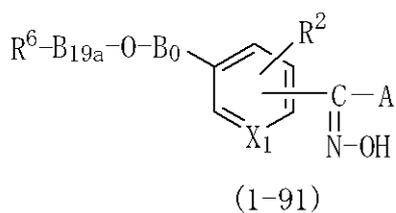
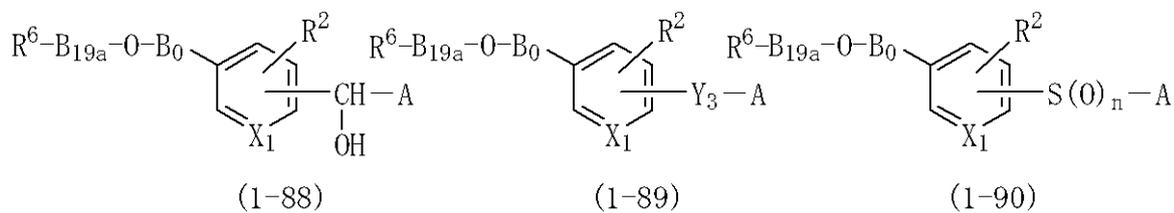
50

下記一般式(1-85)~一般式(1-91)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

【化27】



10



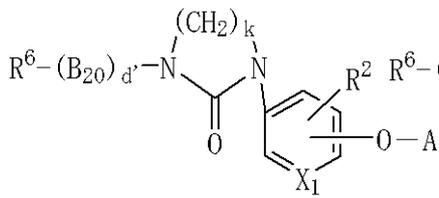
20

[式中、Y₃は、低級アルキレン基を示す。]

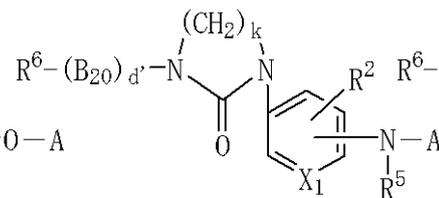
【請求項15】

下記一般式(1-92)~一般式(1-98)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

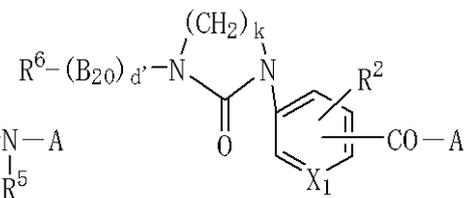
【化 2 8】



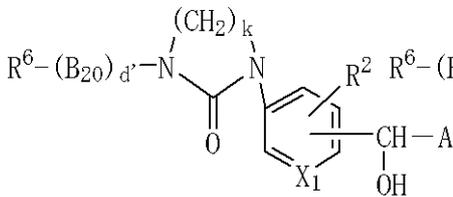
(1-92)



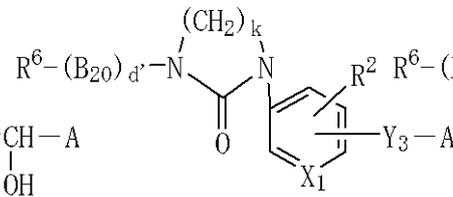
(1-93)



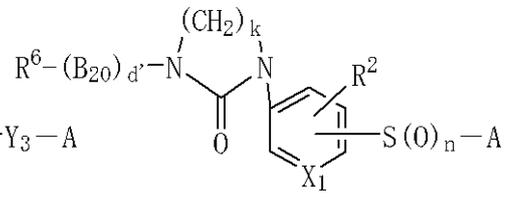
(1-94)



(1-95)

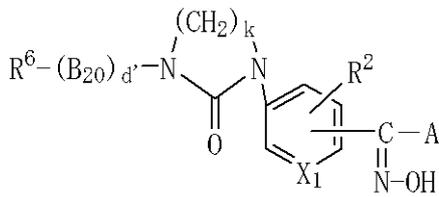


(1-96)



(1-97)

10



(1-98)

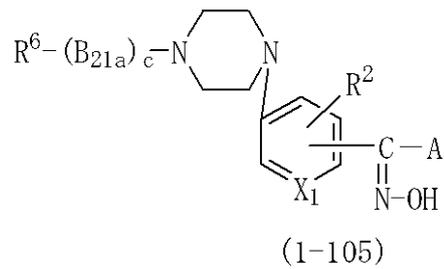
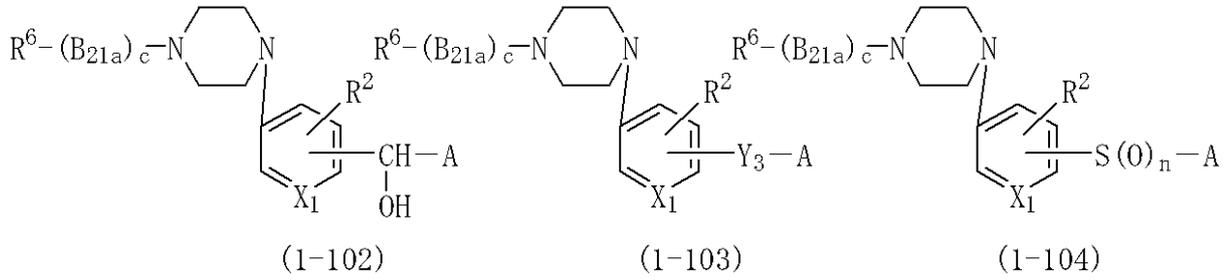
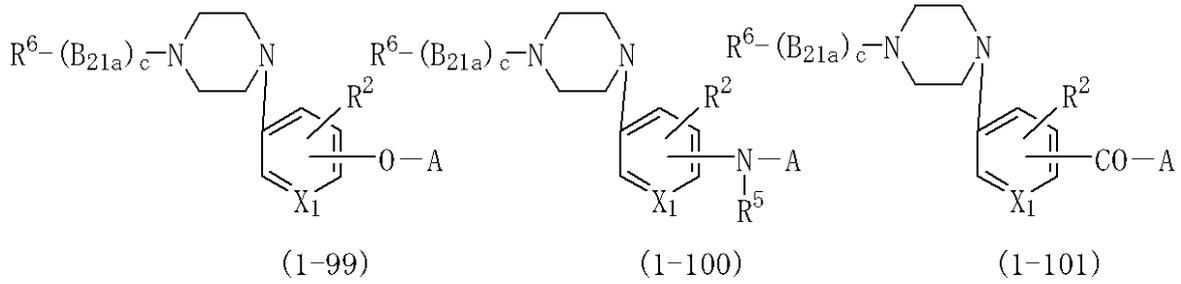
20

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

【請求項 16】

下記一般式(1-99)~一般式(1-105)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

【化 2 9】



[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

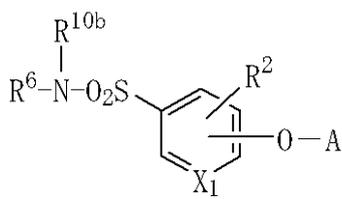
【請求項 17】

下記一般式(1-106)~一般式(1-112)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

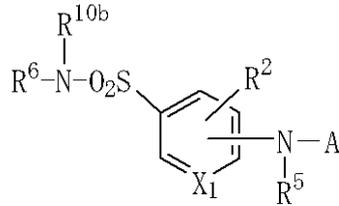
10

20

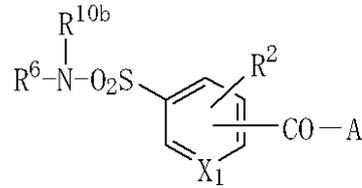
【化 3 0】



(1-106)

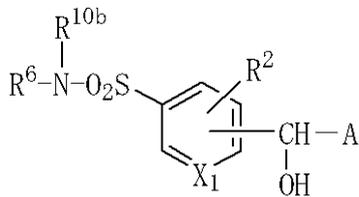


(1-107)

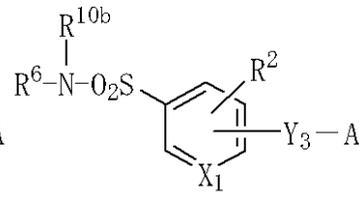


(1-108)

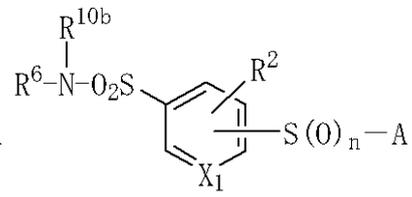
10



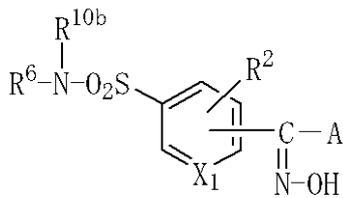
(1-109)



(1-110)



(1-111)



(1-112)

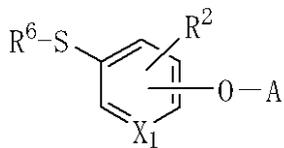
20

[式中、Y₃ は、低級アルキレン基を示す。]

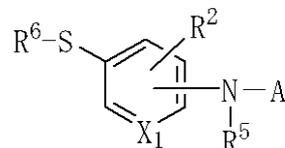
【請求項 1 8】

下記一般式(1-113)～一般式(1-119)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

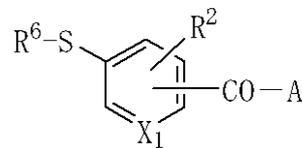
【化 3 1】



(1-113)

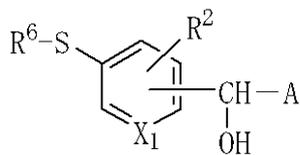


(1-114)

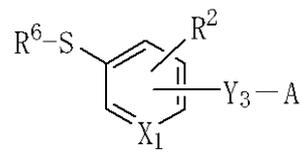


(1-115)

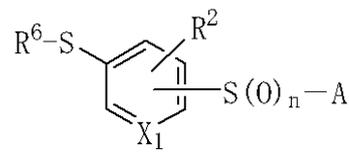
30



(1-116)

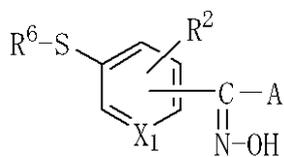


(1-117)



(1-118)

40



(1-119)

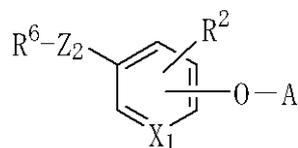
[式中、Y₃ は、低級アルキレン基を示す。]

50

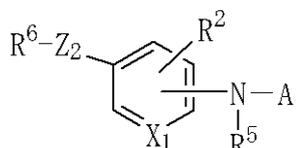
【請求項 19】

下記一般式(1-120)～一般式(1-126)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

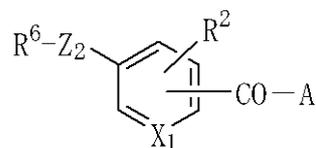
【化32】



(1-120)

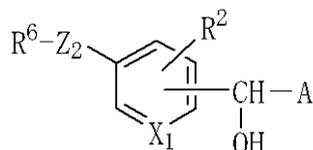


(1-121)

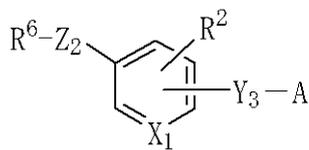


(1-122)

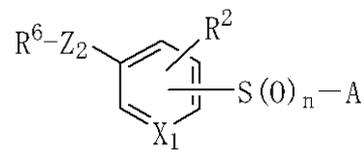
10



(1-123)

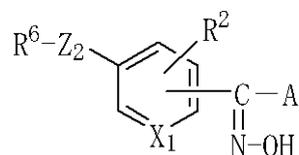


(1-124)



(1-125)

20



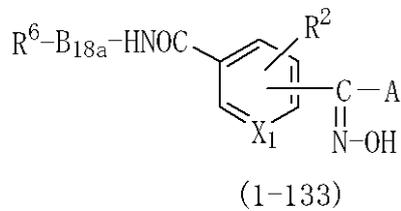
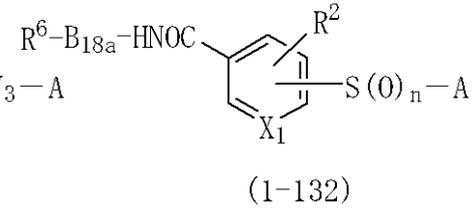
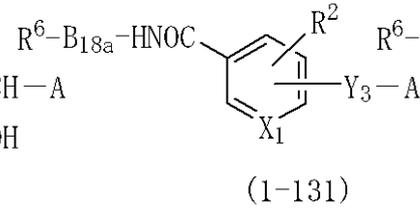
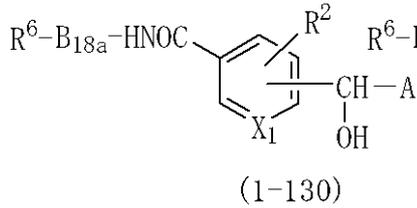
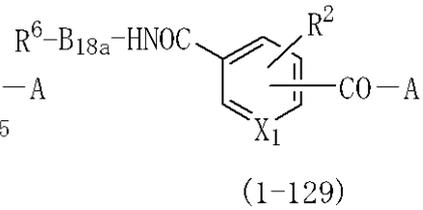
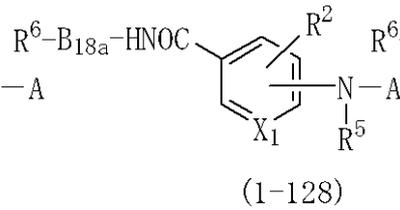
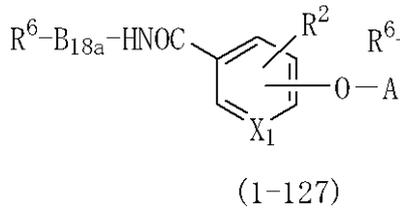
(1-126)

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示し、 Z_2 は、低級アルキニレン基を示す。]

【請求項 20】

下記一般式(1-127)～一般式(1-133)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

【化 3 3】

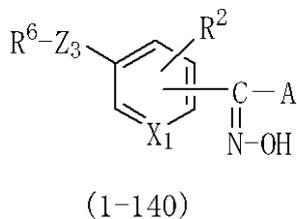
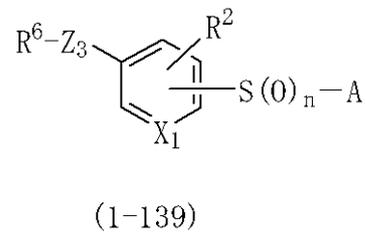
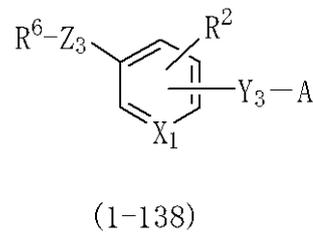
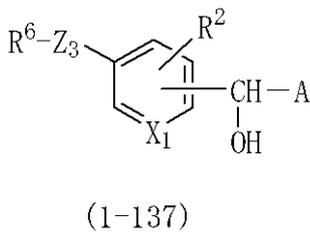
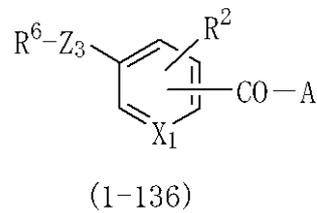
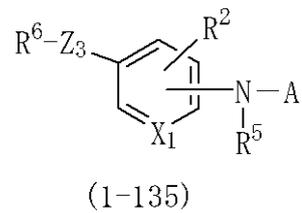
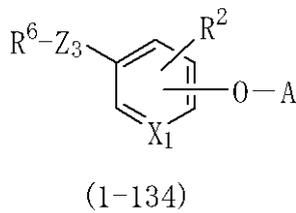


[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

【請求項 2 1】

下記一般式(1-134)~一般式(1-140)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1に記載の阻害剤。

【化 3 4】



[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示し、 Z_3 は、低級アルキレン基又は基 - $\text{N}(\text{R}^8)^d$ - を示す。]

10

20

30

40

50

【請求項 22】

Y が基 - O - を示す、請求項 1 ~ 21 のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項 23】

Y が基 - N (R⁵) - を示す、請求項 1 ~ 21 のいずれか一項に記載の阻害剤。

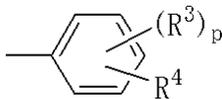
【請求項 24】

Y が基 - CO - 、基 - CH (OH) - 、低級アルキレン基、基 - S (O)_n - 又は基 - C (= N - OH) - を示す、上記 1 ~ 21 のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項 25】

A が基

【化 35】



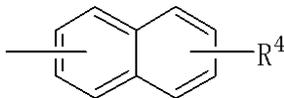
10

を示す、請求項 1 ~ 21 のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項 26】

A が基

【化 36】



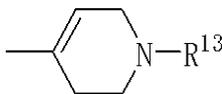
20

を示す、請求項 1 ~ 21 のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項 27】

R⁴ がイミダゾリル低級アルキル基、1, 2, 4 - トリアゾリル低級アルキル基、1, 2, 3 - トリアゾリル低級アルキル基、1, 2, 5 - トリアゾリル低級アルキル基、ピラゾリル低級アルキル基、ピリミジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピリミジニル低級アルキル基、3, 5 - ジオキソイソキサゾリジン - 4 - イリデン低級アルキル基、1, 2, 4 - オキサジアゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのある 1, 2, 4 - オキサジアゾリル低級アルキル基、チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニル低級アルキル基、基

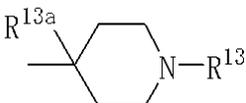
【化 37】



30

又は基

【化 38】



を示す、請求項 1 ~ 21 のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項 28】

40

R⁴ が基 - (T)₁ - N (R¹⁴) R¹⁵ (T、R¹⁴ 及び R¹⁵ は上記に同じ) を示し、l が 0 を示す一般式 (1) で表される、請求項 1 ~ 21 のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項 29】

R⁴ が基 - (T)₁ - N (R¹⁴) R¹⁵ を示し、l が 1 を示す、請求項 1 ~ 21 のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項 30】

R⁴ が基 - (T)₁ - N (R¹⁴) R¹⁵ を示し、l が 1 を示し、T が基 - N (R¹⁷) - B₃ - CO - を示す、請求項 1 ~ 21 のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項 31】

50

R⁴が基 - (T)₁ - N(R¹⁴)R¹⁵を示し、1が1を示し、Tが基 - B₁₉ - N(R¹⁸) - CO - を示す、請求項1～21のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項32】

R⁴が基 - (T)₁ - N(R¹⁴)R¹⁵を示し、1が1を示し、Tが基 - B₄ - CO - を示す、請求項1～21のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項33】

R⁴が基 - (T)₁ - N(R¹⁴)R¹⁵を示し、1が1を示し、Tが基 - Q - B₅ - CO - を示す、請求項1～21のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項34】

R⁴が基 - (T)₁ - N(R¹⁴)R¹⁵を示し、1が1を示し、Tが基 - B₆ - N(R¹⁹) - B₇ - を示す、請求項1～21のいずれか一項に記載の阻害剤。

10

【請求項35】

R⁴が基 - (T)₁ - N(R¹⁴)R¹⁵を示し、1が1を示し、Tが基 - CO - B₈ - を示す、請求項1～21のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項36】

R⁴が基 - (T)₁ - N(R¹⁴)R¹⁵を示し、1が1を示し、Tが基 - CH(OH) - B₉ - を示す、請求項1～21のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項37】

R⁴が基 - (T)₁ - N(R¹⁴)R¹⁵を示し、1が1を示し、Tが基 - CO - B₁₀ - CO - を示す、請求項1～21のいずれか一項に記載の阻害剤。

20

【請求項38】

R⁴が基 - (T)₁ - N(R¹⁴)R¹⁵を示し、1が1を示し、Tが基 - CH(OH) - B₁₁ - CO - を示す、請求項1～21のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項39】

R⁴が基 - (T)₁ - N(R¹⁴)R¹⁵を示し、1が1を示し、Tが基 - CO - を示す、請求項1～21のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項40】

R⁴が基 - (T)₁ - N(R¹⁴)R¹⁵を示し、1が1を示し、Tが基 - SO₂ - を示す、請求項1～21のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項41】

R⁴が基 - (T)₁ - N(R¹⁴)R¹⁵を示し、1が1を示し、Tが基 - B_{23a} - CO - CO - を示す、請求項1～21のいずれか一項に記載の阻害剤。

30

【請求項42】

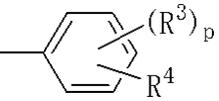
R⁴が基 - (T)₁ - N(R¹⁴)R¹⁵を示し、1が1を示し、Tが低級アルキレン基を示す、請求項1～21のいずれか一項に記載の阻害剤。

【請求項43】

一般式(1-1)、(1-2)、(1-8)、(1-9)、(1-15)、(1-16)、(1-29)、(1-30)、(1-43)、(1-44)、(1-57)、(1-58)、(1-64)及び(1-65)からなる群から選ばれた化合物又はその塩〔式中、Yが基 - O - 又は基 - N(R⁵) - 、Aが基

40

【化39】



を示し、R⁴が基 - (T)₁ - N(R¹⁴)R¹⁵を示す]を有効成分として含む、請求項1記載の阻害剤。

【請求項44】

1が1を示し、Tが基 - N(R¹⁷) - B₃ - CO - を示す、請求項43記載の阻害剤。

【請求項45】

50

ル]メチルアミノ}-2-メトキシフェノキシ)ピリジン-3-イル]-3,4-ジクロロベンズアミド、N-[6-(4-{[2-(4-ピペロニルピペラジン-1-イル)-2-オキソエチル]メチルアミノ}フェノキシ)ピリジン-3-イル]-3,4-ジクロロベンズアミド、1-(6-{4-[3-(4-ピペロニルピペラジン-1-イル)-3-オキソプロピル]フェノキシ}ピリジン-3-イル)-3-(3,4-ジクロロフェニル)-1-エチル尿素、N-(6-{4-[3-(4-ピペロニルピペラジン-1-イル)-3-オキソプロピル]フェノキシ}ピリジン-3-イル)-4-トリフルオロメチルベンズアミド、N-[6-(4-{[2-(4-ベンジルピペラジン-1-イル)-2-オキソエチル]メチルアミノ}-2-メチルフェノキシ)ピリジン-3-イル]-4-トリフルオロメチルベンズアミド、N-[6-(4-{4-[2-(4-ベンジルピペラジン-1-イル)-2-オキソエチル]ピペリジン-1-イル}フェノキシ)ピリジン-3-イル]-3,4-ジクロロベンズアミド、N-(6-{4-[3-(4-ピペロニルピペラジン-1-カルボニル)ピペリジン-1-イル]フェノキシ}ピリジン-3-イル)-3,4-ジクロロベンズアミド、N-[6-(4-{4-[2-(4-ベンジルピペラジン-1-イル)-2-オキソエチル]ピペリジン-1-イル}フェノキシ)ピリジン-3-イル]-4-トリフルオロメチルベンズアミド、N-{6-[4-{4-[2-(4-ベンジルピペラジン-1-イル)-2-オキソエチル]ピペリジン-1-イル}フェニル)メチルアミノ]ピリジン-3-イル}-4-トリフルオロメチルベンズアミド、N-(6-{4-[2-(4-フルオロベンゾイル)フェニル]ピペラジン-1-イル}-2-オキソエチル)メチルアミノ]-2-メトキシフェノキシ}ピリジン-3-イル)-4-トリフルオロメチルベンズアミド、2-(4-ピペロニルピペラジン-1-イル)-N-{3-メチル-4-[5-(4-トリフルオロメチルフェノキシメチル)ピリジン-2-イルオキシ]フェニル}-2-オキソアセトアミド、N-[6-(4-{[2-(4-ピペロニルピペラジン-1-イル)-2-オキソエチル]メチルアミノ}-2-メチルフェノキシ)ピリジン-3-イル]-2-フルオロ-4-トリフルオロメチルベンズアミド、N-[6-(4-{4-[2-(4-ピペロニルピペラジン-1-イル)-2-オキソエチル]ピペリジン-1-イル}-2-メトキシフェノキシ)ピリジン-3-イル]-4-トリフルオロメチルベンズアミド及び4-(3-{3-メチル-4-[5-(4-トリフルオロメチルベンゾイルアミノ)ピリジン-2-イルオキシ]フェニル}-2-オキソヘキサヒドロピリミジン-1-イル)安息香酸エチルエステルからなる群から選ばれた化合物又はその塩を有効成分として含む、請求項1記載の阻害剤。

【請求項49】

請求項1記載中の芳香族化合物において、 R^{14} および R^{15} が、それらが結合する窒素原子と共に、窒素原子を介し又は介することなく互いに結合して形成される6員の飽和複素環基であり、該飽和複素環上に、フェニル環上に置換基として低級アルカノイル基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基及び低級アルキレンジオキシ基からなる群から選ばれた基が1~2個置換していてもよいフェニル置換低級アルキル基が置換している、請求項1記載の阻害剤。

【請求項50】

飽和複素環基であるピペラジニル基上に、低級アルキレンジオキシ基が置換しているフェニル置換低級アルキル基が置換している請求項49記載の阻害剤。

【請求項51】

X_1 が窒素原子、およびYが酸素原子である請求項49又は50記載の阻害剤。

【請求項52】

STAT3活性化に伴う症状又は疾患を予防又は治療するための請求項1記載の阻害剤。

【請求項53】

10

20

30

40

50

S T A T 3 活性化に伴う症状又は疾患が、自己免疫疾患、糖尿病、感染症、中枢性疾患、癌関連疾患又は乾癬である請求項 5 2 記載の S T A T 3 活性化阻害剤。

【請求項 5 4】

請求項 1 に記載されている芳香族化合物 (1) 又はその塩の有効量を患者に投与することにより、S T A T 3 活性化に伴う症状又は疾患を予防又は治療する方法。

【請求項 5 5】

S T A T 5 活性化に伴う症状又は疾患を予防又は治療するための請求項 1 記載の阻害剤。

【請求項 5 6】

S T A T 5 活性化に伴う症状又は疾患が、自己免疫疾患、アレルギー、又は高プロラクチン血症である請求項 5 5 記載の S T A T 5 活性化阻害剤。

10

【請求項 5 7】

請求項 1 に記載されている芳香族化合物 (1) 又はその塩の有効量を患者に投与することにより、S T A T 5 活性化に伴う症状又は疾患を予防又は治療する方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、S T A T 3 / 5 活性化阻害剤に関する。

【背景技術】

【0002】

20

タンパク質の S T A T (signal transducers and activators of transcription) ファミリーは、DNA結合タンパク質であり、情報伝達及び転写活性化において役割を果たす。現在、S T A T ファミリーには、6つの異なるメンバー (S T A T 1、S T A T 2、S T A T 3、S T A T 4、S T A T 5、及び S T A T 6) 及びいくつかのアイソフォーム (S T A T 1、S T A T 1、S T A T 3、S T A T 3、S T A T 5a及び S T A T 5b) が知られている。S T A T の活性は、多様なサイトカイン及びマイトジェン刺激により調節される。サイトカインがその受容体に結合すると、これらの受容体と関連するヤヌス (J a n u s) プロテインチロシンキナーゼ (J A K) の活性化が生じる。

【0003】

30

S T A T 3 は、特異的リン酸化チロシン構造を認識する S H 2 (src homology 2) ドメインを有し、g p 1 3 0 細胞内領域リン酸化チロシンを特異的に認識し、g p 1 3 0 上に運ばれてくると考えられ、J A K によりチロシンリン酸化される。チロシンリン酸化された S T A T 3 は、自身の S H 2 ドメインを介して S T A T 3 二量体 (homodimer) あるいは S T A T 1 との二量体 (heterodimer) を形成し、核内へ移行し、特異的 DNA 配列を認識して結合し、多くの遺伝子の転写を制御していることが知られている。

【0004】

S T A T 3 / 5 のそのような生体内における役割についてはいくつかの報告が存在する。

【0005】

40

例えば、非特許文献 1 には、S T A T 3 活性化と I L - 6 - signaling pathways、および I L - 6 とアルツハイマー病、リウマチ、クローン病、貧血などの慢性疾患や悪液質 (カケクシア) などの癌関連疾患との関係が記載されている。

【0006】

また、非特許文献 2 には、S T A T 3 活性化と Hepatitis C Virus との関係が、非特許文献 3 には、S T A T 3 活性化と乾癬との関係がそれぞれ記載されている。また、特許文献 2 には、S T A T 3 と炎症性疾患および自己免疫疾患との関係が、また非特許文献 4 には、S T A T 3 活性化と肥満、糖尿病、不妊症、thermal dysregulation 等との関係がそれぞれ記載されている。非特許文献 5 及び 6 等には、S T A T 5 が I g E 誘導 MC (マスト細胞) 活性化、並びに炎症性および自己免疫疾患における重要な因子であることが記載されており、またアレルギー、炎症、高プロラクチン血症および悪性腫瘍における S T A T 5 の役割が記

50

載されている。

【0007】

一方、コラーゲン産生阻害作用を有する芳香族化合物の存在が知られている（特許文献1）。しかしながら、特許文献1に記載されている芳香族化合物がSTAT3/5活性化阻害作用を有することは未だ知られていない。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0008】

【特許文献1】WO2006/014012

【特許文献2】US2001/0029250

10

【非特許文献】

【0009】

【非特許文献1】J.Gerontology; MEDICAL SCIENCES 2006, Vol.61A, No.6, 575-584

【非特許文献2】J. Exp. Med.Vol.196, No.5, 2002, 641-653

【非特許文献3】Nature Medicine Vol.11, No.1, 2005, 43-49

【非特許文献4】P N A S March 30, 2004, vol.101, no.13, 4661-4666

【非特許文献5】J. Immunology, 2006, 177:3421-3426

【非特許文献6】Ann.Rheum.Dis.2004;63:67-71

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

20

【0010】

本発明は、STAT3/5活性化阻害剤を提供することを課題とする。

【課題を解決するための手段】

【0011】

本発明者らは、特許文献1に記載されている芳香族化合物につき更に研究を重ねた結果、該化合物がSTAT3/5活性化阻害作用を有していることを見出した。本発明は、このような知見に基づき完成されたものである。

【0012】

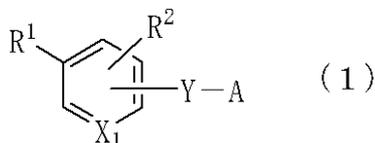
従って、本発明は、下記A項～C項に示すSTAT3/5活性化阻害剤を提供する。

項A. 一般式

30

【0013】

【化1】



【0014】

[式中、X₁は、窒素原子又は基 - CH = を示す。

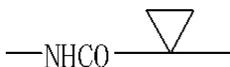
R¹は、基 - Z - R⁶を示す。

Zは、基 - N(R⁸) - B - 、基 - B - N(R⁸) - 、基 - B₀ - O - 、基

40

【0015】

【化2】

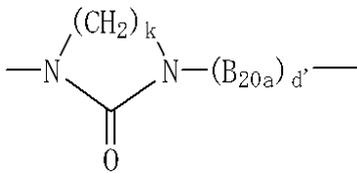


【0016】

、基 - CO - 、基 - CH(OH) - 、基 - N(R^{9a}) - CO - N(R^{9b}) - 、基 - N = CH - 、基 - N(R^{10a}) - SO₂ - (B_{22a})e - 、低級アルケニレン基、基 - NHCO - B₁ - 、基 - NHCO - B₂ - (W)u - 、基 - B₀ - O - B_{19a} - 、基

【0017】

【化 3】

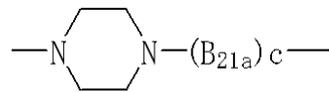


【0018】

、基

【0019】

【化 4】



【0020】

、基 - SO_2 - $\text{N}(\text{R}^{10b})$ - 、基 - S - 、低級アルキニレン基、低級アルキレン基、
基 - $\text{N}(\text{R}^{8d})$ - 又は基 - $\text{CO} - \text{NH} - \text{B}_{18a}$ - を示す。

R^{8d} は、水素原子、置換基として低級アルコキシ基を有することのある低級アルキル基、
低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル低級アルキル基を示す。

B は、基 - CO - 又は低級アルキレン基を示す。

B_0 は、低級アルキレン基を示す。

B_1 は、置換基としてフェニル基を有することのある低級アルケニレン基を示す。

B_2 は、低級アルコキシ基及びフェニル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい低
級アルキレン基を示す。

R^{9a} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

R^{9b} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

R^{10a} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

B_{22a} は、低級アルキレン基又は低級アルケニレン基を示す。

e は、0 又は 1 を示す。

B_{18a} は、低級アルキレン基を示す。

B_{19a} は、低級アルキレン基を示す。

B_{20a} は、低級アルキレン基を示す。

B_{21a} は、低級アルキレン基を示す。

k は、2 又は 3 を示す。

c は 0 又は 1 を示す。

d' は 0 又は 1 を示す。

R^{10b} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

R^{8d} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

W は、酸素原子、基 - NH - 又は硫黄原子を示す。

u は、0 又は 1 を示す。

R^6 は、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を 1 ~ 4 個有する 5 ~ 15 員の単環、二項環又
は三項環の飽和又は不飽和複素環基（該複素環上には、オキソ基；置換基としてハロゲン
原子を有することのある低級アルコキシ基；置換基としてハロゲン原子を有することのある
低級アルキル基；ハロゲン原子；低級アルキルスルホニル基；フェニル環上にハロゲン
原子を有することのある低級アルキル基が置換していてもよいフェニル基；低級アルキル
チオ基；ピロリル基；ベンゾイル基；低級アルカノイル基；低級アルコキシカルボニル基
；並びに置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群から選ばれた基を有
することのあるアミノ基なる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよい）、アダマ
ンチル基、ナフチル基（ナフタレン環上に低級アルキル基、ハロゲン原子並びに置換基と
して低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群から選ばれた基を有することのあるア
ミノ基なる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよい）、置換基として低級アルコ

10

20

30

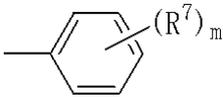
40

50

キシ基を有することのあるアルキル基、シクロアルキル環上に低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよいシクロアルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルケニル基、低級アルカノイル基、ベンゾイル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及びハロゲン原子なる群から選ばれた基が1～3個有していてもよい）、ハロゲン原子置換低級アルキル基、シクロアルキル低級アルキル基又は基

【0021】

【化5】



10

【0022】

を示す。

R⁷は、水素原子、フェニル基、カルボキシ基、水酸基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、フェノキシ基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、低級アルキレンジオキシ基、置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、ベンゾイル基及びシクロアルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基、シアノ基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、アミノスルホニル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイルオキシ基、低級アルコキシカルボニル低級アルキル基或いは窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する5～6員の飽和又は不飽和複素環基（該複素環上にはオキソ基が置換していてもよい）を示す。

20

mは、1～5の整数を示す。mが2～5を示す場合、2～5個のR⁷は、同一であってもよいし、異なってもよい。

R²は、水素原子、ハロゲン原子又は低級アルキル基を示す。

Yは、基-O-、基-N(R⁵)-、基-CO-、基-CH(OH)-、低級アルキレン基、基-S(O)_n-又は基-C(=N-OH)-を示す。

R⁵は、水素原子、低級アルキル基、低級アルカノイル基、ベンゾイル基、フェニル低級アルキル基又はシクロアルキル基を示す。

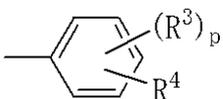
30

nは、0、1又は2を示す。

Aは、基

【0023】

【化6】

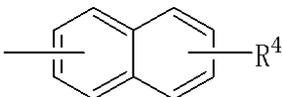


【0024】

又は基

【0025】

【化7】



【0026】

を示す。

pは、1又は2を示す。

R³は、水素原子、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、基-CONR¹¹R¹²又はシアノ基を示す。

50

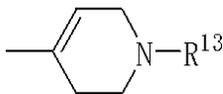
R^{1 1} 及び R^{1 2} は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、シクロアルキル基又はフェニル基を示す。また、R^{1 1} と R^{1 2} とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、硫黄原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して 5 ~ 7 員の飽和複素環を形成してもよい。

R⁴ は、イミダゾリル低級アルキル基、1, 2, 4 - トリアゾリル低級アルキル基、1, 2, 3 - トリアゾリル低級アルキル基、1, 2, 5 - トリアゾリル低級アルキル基、ピラゾリル低級アルキル基、ピリミジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピリミジニル低級アルキル基、3, 5 - ジオキソイソキサゾリジン - 4 - イリデン低級アルキル基、1, 2, 4 - オキサジアゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのある 1, 2, 4 - オキサジアゾリル低級アルキル基、チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニル低級アルキル基、基

10

【0027】

【化8】

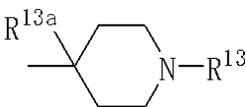


【0028】

、基

【0029】

【化9】



20

【0030】

又は基 - (T)₁ - N(R^{1 4})R^{1 5} を示す。

R^{1 3} は、水素原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基、イミダゾリル低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、カルボキシ低級アルキル基、ベンゾイル基、モルホリノ置換低級アルカノイル基、フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基がピペラジン環上に置換していてもよいピペラジニルカルボニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基がピペラジン環上に置換していてもよいピペラジニル低級アルカノイル基、モルホリノカルボニル置換低級アルキル基又はイミダゾリル低級アルカノイル基を示す。

30

R^{1 3 a} は、水素原子又は水酸基を示す。

T は、低級アルキレン基、基 - N(R^{1 7}) - B₃ - CO - 、基 - B_{1 9} - N(R^{1 8}) - CO - 、基 - B₄ - CO - 、基 - Q - B₅ - CO - 、基 - B₆ - N(R^{1 9}) - B₇ - CO - 、基 - CO - B₈ - 、基 - CH(OH) - B₉ - 、基 - CO - B_{1 0} - CO - 、基 - CH(OH) - B_{1 1} - CO - 、基 - CO - 、基 - SO₂ - 又は基 - B_{2 3 a} - CO - CO - を示す。

40

R^{1 7} は、水素原子、低級アルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキルカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することある低級アルカノイル基、低級アルケニル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイル基又は低級アルキルスルホニル基を示す。

B₃ は、低級アルキレン基を示す。

B_{1 9} は、低級アルキレン基を示す。

R^{1 8} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

B₄ は、低級アルケニレン基又は置換基として水酸基を有することのある低級アルキレン

50

基を示す。

Q は、酸素原子又は基 - S (O) n - (n は前記に同じ) を示す。

B₅ は、低級アルキレン基を示す。

B₆ は、低級アルキレン基を示す。

R^{1 9} は、水素原子又は低級アルカノイル基を示す。

B₇ は、低級アルキレン基を示す。

B₈ は、低級アルキレン基を示す。

B₉ は、低級アルキレン基を示す。

B₁₀ は、低級アルキレン基を示す。

B₁₁ は、低級アルキレン基を示す。

B_{23a} は、低級アルキレン基を示す。

l は、0 又は 1 を示す。

R^{1 4} は、水素原子又は置換基として水酸基を有することのあるアルキル基を示す。R¹

⁵ は、(2)水酸基置換アルキル基、(3)置換基として水酸基及び低級アルキル基なる群から

選ばれた基を有することのあるシクロアルキル基、(4)フェノキシ低級アルキル基、(5)フェ

ニル環上に低級アルキル基；置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコ

キシ基；ハロゲン原子；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ低級アル

コキシ基；水酸基置換低級アルキル基；フェニル低級アルキル基；低級アルキニル基；置

換基として低級アルキルスルホニル基を有することのあるアミノ基；低級アルキルチオ基

；シクロアルキル基；フェニルチオ基；アダマンチル基；フェニル環上に置換基としてハ

ロゲン原子を有することのあるアニリノ基；低級アルコキシカルボニル基；ピペラジン環

上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペラジニル基；ピロリジン環上

に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニル基；低級アルカノイルアミノ基；

シアノ基；及びフェノキシ基なる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよいフェ

ニル基、(6)フェノキシ基、(7)フェニル環上にハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を

有することのある低級アルコキシ基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個

置換していてもよいフェニル低級アルキル基、(8)フェニル環上に置換基として低級アル

キレンジオキシ基を有するフェニル低級アルキル基、(10)低級アルコキシカルボニル置換

低級アルキル基、(11)カルボキシ置換低級アルキル基、(12)置換基として低級アルカノ

イル基を有することのあるアミノ基、(13)テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキソ

基、低級アルコキシ基及び低級アルキレンジオキシ基なる群から選ばれた基を 1 ~ 3 個有

することのある 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル基、(14)シクロアルキル低級アル

キル基、(15)フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのある

フェニル低級アルキル基がピペラジン環上に置換していてもよいピペラジニル低級アルカ

ノイル基、(16)ピリジル低級アルキル基、(17)置換基として低級アルキル基及び低級アル

カノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基置換低級アルキル基、(18)

低級アルコキシ低級アルキル基、(19)イミダゾリル基、(20)イミダゾリル低級アルキル基

、(21) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリルカルボニル置換低級アルキル基、(22)

ピペリジン環上に置換基として低級アルコキシカルボニル基、フェニル低級アルキル基及

びフリル低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピペリジニルカルボ

ニル基、(23)チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニル

低級アルカノイル基、(24)ピペリジン環上に低級アルコキシカルボニル基、フェニル低級

アルキル基、低級アルキル基、ベンゾイル基及びフリル低級アルキル基なる群から選ば

れた基が置換していてもよいピペリジニル基、(25)基

【 0 0 3 1 】

【 化 1 0 】



【 0 0 3 2 】

10

20

30

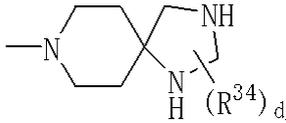
40

50

が置換したカルボニル低級アルキル基、(26)基

【0033】

【化11】



【0034】

が置換したカルボニル低級アルキル基、(27)基 - CO - B₂₀ - N(R³⁶)R³⁷、(26a)ピロリジニル低級アルキル基、(27a)モルホリノ低級アルキル基、(28a)フェニル低級アルケニル基、(29a)フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノカルボニル低級アルキル基、(30a)インドリル基、(31a)ピペラジン環上に置換基として低級アルキル基及びフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピペラジニル低級アルキル基、(32a)置換基として低級アルキル基を有することのあるアミジノ低級アルキル基、(33a)フルオレニル基、(34a)カルバゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるカルバゾリル基、(35a)置換基として低級アルキル基を有することのあるアミジノ基、(36a)ピペラジン環上に置換基としてフェニル低級アルキル基(フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基及び低級アルコキシ基なる群から選ばれた基1~3個有していてもよい)及びピリジル低級アルキル基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるピペラジニル置換オキサリル基又は(37a)シアノ置換低級アルキル基を示す。

10

20

30

50

R³⁴は、オキソ基又はフェニル基を示す。

dは、0~3の整数を示す。

B₂₀は、低級アルキレン基を示す。

R³⁶及びR³⁷は、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成される5~7員の飽和複素環基を示す。該複素環基上には、フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基が1~3個置換していてもよい。

R¹⁴とR¹⁵とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5~10員の飽和又は不飽和複素環；或いは基

【0035】

【化12】



【0036】

を形成してもよい。該複素環上には、(28)フェニル環上に置換基として低級アルカノイル基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基及び低級アルキレンジオキシ基なる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよいフェニル基を1~2個有し、低級アルキル基上にピリジル基を有することのあるフェニル置換低級アルキル基、(29)カルバモイル基、(30)ピリジン環上に置換基として水酸基及び置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるピリジル低級アルキル基、(31)ピロール環上に置換基として低級アルキル基を1~3個有することのあるピロリル低級アルキル基、(32)ベンゾオキサゾリル低級アルキル基、(33)ベンゾチアゾリル低級アルキル基、(34)フリル低級アルキル基、(35)フェニル環上にシアノ基、置換基として低級

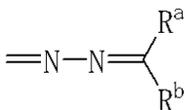
40

50

アルキルスルホニル基を有することのあるアミノ基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニル低級アルキル基、チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニリデン低級アルキル基及び低級アルキレンジオキシ基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよいベンゾイル基、(36)ピリミジニル基、(37)ピラジニル基、(38)ピリジル基、(39)低級アルコキシカルボニル基、(40)チアゾリジン環上にオキソ基及び基

【0037】

【化13】



【0038】

(R^a 及び R^b は、それぞれ低級アルキル基を示す。) なる群より選ばれた基が置換していてもよいチアゾリジニル低級アルカノイル基、(41)置換基として水酸基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのある低級アルキル基、(42)置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基、(43)フェニル環上に低級アルコキシ低級アルキル基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるカルバモイル基、低級アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、シアノ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルキル基及び水酸基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよいフェニル基、(44)フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有するフェニル基、(45)ナフチル低級アルキル基、(46)フェニル環上にシアノ基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基なる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよいフェノキシ基、(47)フェノキシ低級アルキル基、(48)フェニル環上にハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよいフェニル低級アルコキシ基、(49)基 - (B_{12}CO) t - $\text{N}(\text{R}^{20})\text{R}^{21}$ 、(50)基 - (CO) o - B_{13} - $\text{N}(\text{R}^{22})\text{R}^{23}$ 、(51)1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン環上に置換基として低級アルキル基を1～5個有していてもよい1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフチル置換低級アルキル基、(52)置換基として水酸基を有することのあるシクロアルキル基、(53)ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を1～3個有していてもよいピペリジニル基、(54)キノリル低級アルキル基、(55)テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのある1, 2, 3, 4 - テトラゾリル低級アルキル基、(56)チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリル低級アルキル基、(57)フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基及びハロゲン原子なる群から選ばれる基を1～3個有することのあるベンゾイル低級アルキル基、(58)ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニル低級アルキル基、(59)イミダゾール環上に置換基としてフェニル基を1～3個有することのあるイミダゾリル基、(60)ベンズイミダゾール環上に置換基として低級アルキル基を1～3個有することのあるベンズイミダゾリル基、(61)ピリジル低級アルコキシ基、(62)テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキソ基を有することのある1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル低級アルキル基、(63)1, 3, 4 - オキサジアゾール環上に置換基としてオキソ基を有することのある1, 3, 4 - オキサジアゾリル低級アルキル基、(64)シクロアルキル低級アルキル基、(65)テトラヒドロピラニル基、(66)チエニル低級アルキル基、(67)ピリミジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピリミジニルカルボニル基、(68)水酸基、(69)カルボキシ基、(70)低級アルコキシ低級アルキ

10

20

30

40

50

ル基、(71)低級アルコキシ低級アルコキシ基、(72)ベンゾイルオキシ基、(73)低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基、(74)カルボキシ低級アルコキシ基、(75)フェノキシ低級アルカノイル基、(76)テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキシ基を有することのある1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリルカルボニル基、(77)フェニルスルホニル基、(78)イミダゾリル低級アルカノイル基、(79)イミダゾリル低級アルキル基、(80)ピリジルカルボニル基、(81)イミダゾリルカルボニル基、(82)低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、(83)カルボキシ低級アルキル基、(84)基 - (O - B₁₅)_s - CO - N(R²⁶)R²⁷、(85)基 - N(R²⁸) - CO - B₁₆ - N(R²⁹)R³⁰、(86)基 - N(R³¹) - B₁₇ - CO - N(R³²)R³³、(87)ベンゾオキサゾリル基、(88a)ベンゾチエニル基、(89a)オキシ基及び(90a)テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキシ基を有することのある1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基なる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよい。

B₁₂は、低級アルキレン基を示す。

tは、0又は1を示す。

R²⁰及びR²¹は、同一又は異なって、水素原子；置換基として低級アルコキシカルボニル基を有することのあるアミノ基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を1~3個有することのあるベンゾイル基；低級アルキル基；フェニル環上に低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基及び低級アルキルチオ基なる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよいフェニル基を1~2個有する低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよいフェニル基；低級アルコキシカルボニル基；シクロアルキル低級アルキル基；ピロリジン環上に置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基を1~3個有することのあるピロリジニル低級アルキル基；置換基としてフェニル基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基；1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上に置換基として低級アルキル基を1~5個有していてもよい1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル置換低級アルキル基；ナフチル低級アルキル基；ピリジル低級アルキル基；キノリル低級アルキル基；テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基を1~3個有することのある1, 2, 3, 4-テトラゾリル低級アルキル基；1, 2, 4-トリアゾリル低級アルキル基；低級アルキル基上に置換基として水酸基を有することのあるテトラヒドロフリル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びニトロ基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル低級アルカノイル基；置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基；イミダゾリル低級アルカノイル基；低級アルコキシカルボニル低級アルキル基；ピリジル基；カルボキシ低級アルキル基又はシクロアルキル基を示す。また、R²⁰とR²¹とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5~7員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子及びハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるフェニル基並びにフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよい。

oは、0又は1を示す。

B₁₃は、低級アルキレン基を示す。

R²²及びR²³は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を1~3個有することのあるベンゾイル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、フェニル低級アルキル基又はフェニル基を示す。また、R²²とR²³とは、これらが結合する窒素

10

20

30

40

50

原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい。

B_{15} は、低級アルキレン基を示す。

s は、0又は1を示す。

R^{26} 及び R^{27} は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、フェニル低級アルキル基又はイミダゾリル低級アルキル基を示す。また、 R^{26} と R^{27} とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基を1～3個有していてもよい。

R^{28} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

B_{16} は、低級アルキレン基を示す。

R^{29} 及び R^{30} は、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成される5～7員の飽和複素環基を示す。該複素環上には、低級アルキル基、フェニル基及びフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい。

R^{31} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

B_{17} は、低級アルキレン基を示す。

R^{32} 及び R^{33} は、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成される5～7員の飽和複素環基を示す。該複素環上には、低級アルキル基、フェニル基及びフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい。

【0039】

但し、下記(i)～(v)の要件を満たしているものとする。

【0040】

(i) X_1 が基 - CH = を示すとき、 R^3 は水素原子を示す。

【0041】

(ii) X_1 が基 - CH = を示し、 l が1を示し、 T が - CO - を示し、かつ R^{14} が水素原子又は置換基として水酸基を有することのあるアルキル基を示すとき、 R^{15} は基(24)を示す。

【0042】

(iii) X_1 が基 - CH = を示し、 l が1を示し、かつ T が - N(R^{17}) - B_3 - CO - を示すとき、 R^{14} 及び R^{15} は、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～10員の飽和又は不飽和複素環を形成し、かつ該複素環上には、基(28)が1～3個置換されている。

【0043】

(iv) X_1 が窒素原子を示しかつ l が0であるとき、又は X_1 が窒素原子を示し、 l が1であり、かつ T が - CO - もしくは - SO₂ を示すとき、 R^{15} は、基(5)、(7)、(19)及び(20)ではない。

【0044】

(v) R^6 がシクロアルキル環上に低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよいシクロアルキル基を示すとき、 R^4 は基 - (T)₁ - N(R^{14}) R^{15} を示すものとする。(T及び l は、前記に同じ。 R^{14} 及び R^{15} は、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～10員の飽和複素環；或いは基

10

20

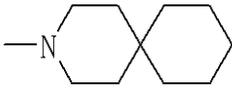
30

40

50

【 0 0 4 5 】

【 化 1 4 】



【 0 0 4 6 】

を形成する。)]

で表される芳香族化合物 (以下単に芳香族化合物 (1) と示すこともある) 又はその塩を有効成分として含有する S T A T 3 / 5 活性化阻害剤。

10

【 0 0 4 7 】

項 B . S T A T 3 活性化に伴う症状又は疾患を予防又は治療するための A 項記載の S T A T 3 活性化阻害剤。

【 0 0 4 8 】

項 C . S T A T 3 活性化に伴う症状又は疾患が、自己免疫疾患、糖尿病、感染症、中枢性疾患、癌関連疾患又は乾癬である B 項記載の S T A T 3 活性化阻害剤。

【 0 0 4 9 】

また本発明は、A 項に記載されている芳香族化合物 (1) 又はその塩の有効量を患者に投与することにより、S T A T 3 活性化に伴う症状又は疾患を予防又は治療する方法を提供する。

20

【 0 0 5 0 】

さらに本発明は、S T A T 3 / 5 活性化阻害剤を製造するための、A 項に記載されている化合物 (1) 又はその塩の使用を提供する。

【 0 0 5 1 】

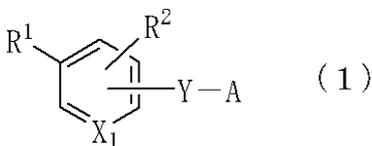
本発明の S T A T 3 / 5 活性化阻害剤の有効成分である芳香族化合物 (1) 又はその塩は、以下の 1 項に示す芳香族化合物 (1) 又はその塩であり、2 項 ~ 4 8 項に示す芳香族化合物又はその塩が好ましい：

項 1 : 一般式

【 0 0 5 2 】

30

【 化 1 5 】



【 0 0 5 3 】

[式中、X₁ は、窒素原子又は基 - C H = を示す。

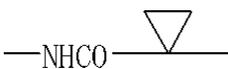
R¹ は、基 - Z - R⁶ を示す。

Z は、基 - N (R⁸) - B - 、基 - B - N (R⁸) - 、基 - B₀ - O - 、基

【 0 0 5 4 】

40

【 化 1 6 】

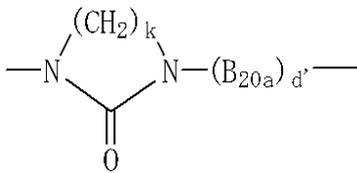


【 0 0 5 5 】

、基 - C O - 、基 - C H (O H) - 、基 - N (R^{9 a}) - C O - N (R^{9 b}) - 、基 - N = C H - 、基 - N (R^{1 0 a}) - S O₂ - (B_{2 2 a}) e - 、低級アルケニレン基、基 - N H C O - B₁ - 、基 - N H C O - B₂ - (W) u - 、基 - B₀ - O - B_{1 9 a} - 、基

【 0 0 5 6 】

【化 1 7】

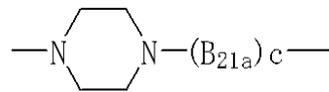


【 0 0 5 7】

、基

【 0 0 5 8】

【化 1 8】



【 0 0 5 9】

、基 - SO₂ - N(R^{10b}) - 、基 - S - 、低級アルキニレン基、低級アルキレン基、
基 - N(R^{8d}) - 又は基 - CO - NH - B_{18a} - を示す。

R⁸ は、水素原子、置換基として低級アルコキシ基を有することのある低級アルキル基、
低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル低級アルキル基を示す。

B は、基 - CO - 又は低級アルキレン基を示す。

B₀ は、低級アルキレン基を示す。

B₁ は、置換基としてフェニル基を有することのある低級アルケニレン基を示す。

B₂ は、低級アルコキシ基及びフェニル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい低
級アルキレン基を示す。

R^{9a} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

R^{9b} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

R^{10a} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

B_{22a} は、低級アルキレン基又は低級アルケニレン基を示す。

e は、0 又は 1 を示す。

B_{18a} は、低級アルキレン基を示す。

B_{19a} は、低級アルキレン基を示す。

B_{20a} は、低級アルキレン基を示す。

B_{21a} は、低級アルキレン基を示す。

k は、2 又は 3 を示す。

c は 0 又は 1 を示す。

d' は 0 又は 1 を示す。

R^{10b} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

R^{8d} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

W は、酸素原子、基 - NH - 又は硫黄原子を示す。

u は、0 又は 1 を示す。

R⁶ は、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を 1 ~ 4 個有する 5 ~ 15 員の単環、二項環又
は三項環の飽和又は不飽和複素環基（該複素環上には、オキソ基；置換基としてハロゲン
原子を有することのある低級アルコキシ基；置換基としてハロゲン原子を有することの
ある低級アルキル基；ハロゲン原子；低級アルキルスルホニル基；フェニル環上にハロゲン
原子を有することのある低級アルキル基が置換していてもよいフェニル基；低級アルキル
チオ基；ピロリル基；ベンゾイル基；低級アルカノイル基；低級アルコキシカルボニル基
；並びに置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群から選ばれた基を有
することのあるアミノ基なる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよい）、アダマ
ンチル基、ナフチル基（ナフタレン環上に低級アルキル基、ハロゲン原子並びに置換基と
して低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群から選ばれた基を有することのあるア
ミノ基なる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよい）、置換基として低級アルコ

10

20

30

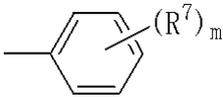
40

50

キシ基を有することのあるアルキル基、シクロアルキル環上に低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよいシクロアルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルケニル基、低級アルカノイル基、ベンゾイル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及びハロゲン原子なる群から選ばれた基が1～3個有していてもよい）、ハロゲン原子置換低級アルキル基、シクロアルキル低級アルキル基又は基

【0060】

【化19】



10

【0061】

を示す。

R⁷ は、水素原子、フェニル基、カルボキシ基、水酸基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、フェノキシ基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、低級アルキレンジオキシ基、置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、ベンゾイル基及びシクロアルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基、シアノ基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基、アミノスルホニル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイルオキシ基、低級アルコキシカルボニル低級アルキル基或いは窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1～4個有する5～6員の飽和又は不飽和複素環基（該複素環上にはオキソ基が置換していてもよい）を示す。

20

mは、1～5の整数を示す。mが2～5を示す場合、2～5個のR⁷は、同一であってもよいし、異なってもよい。

R² は、水素原子、ハロゲン原子又は低級アルキル基を示す。

Yは、基-O-、基-N(R⁵)-、基-CO-、基-CH(OH)-、低級アルキレン基、基-S(O)_n-又は基-C(=N-OH)-を示す。

R⁵ は、水素原子、低級アルキル基、低級アルカノイル基、ベンゾイル基、フェニル低級アルキル基又はシクロアルキル基を示す。

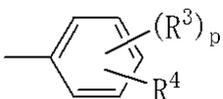
30

nは、0、1又は2を示す。

Aは、基

【0062】

【化20】

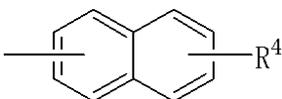


【0063】

又は基

【0064】

【化21】



【0065】

を示す。

pは、1又は2を示す。

R³ は、水素原子、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、基-CONR^{1 1}R^{1 2}又はシアノ基を示す。

50

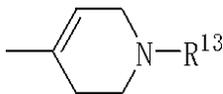
R^{11} 及び R^{12} は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、シクロアルキル基又はフェニル基を示す。また、 R^{11} と R^{12} とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、硫黄原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員の飽和複素環を形成してもよい。

R^4 は、イミダゾリル低級アルキル基、1,2,4-トリアゾリル低級アルキル基、1,2,3-トリアゾリル低級アルキル基、1,2,5-トリアゾリル低級アルキル基、ピラゾリル低級アルキル基、ピリミジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピリミジニル低級アルキル基、3,5-ジオキソイソキサゾリジン-4-イリデン低級アルキル基、1,2,4-オキサジアゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのある1,2,4-オキサジアゾリル低級アルキル基、チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニル低級アルキル基、基

10

【0066】

【化22】

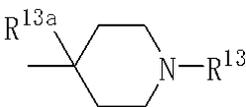


【0067】

、基

【0068】

【化23】



20

【0069】

又は基 - (T)₁ - N(R¹⁴)R¹⁵ を示す。

R^{13} は、水素原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基、イミダゾリル低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、カルボキシ低級アルキル基、ベンゾイル基、モルホリノ置換低級アルカノイル基、フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基がピペラジン環上に置換していてもよいピペラジニルカルボニル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基がピペラジン環上に置換していてもよいピペラジニル低級アルカノイル基、モルホリノカルボニル置換低級アルキル基又はイミダゾリル低級アルカノイル基を示す。

30

R^{13a} は、水素原子又は水酸基を示す。

T は、低級アルキレン基、基 - N(R¹⁷) - B₃ - CO - 、基 - B₁₉ - N(R¹⁸) - CO - 、基 - B₄ - CO - 、基 - Q - B₅ - CO - 、基 - B₆ - N(R¹⁹) - B₇ - CO - 、基 - CO - B₈ - 、基 - CH(OH) - B₉ - 、基 - CO - B₁₀ - CO - 、基 - CH(OH) - B₁₁ - CO - 、基 - CO - 、基 - SO₂ - 又は基 - B_{23a} - CO - CO - を示す。

40

R^{17} は、水素原子、低級アルキル基、シクロアルキル基、シクロアルキルカルボニル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基、低級アルケニル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイル基又は低級アルキルスルホニル基を示す。

B₃ は、低級アルキレン基を示す。

B₁₉ は、低級アルキレン基を示す。

R^{18} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

B₄ は、低級アルケニレン基又は置換基として水酸基を有することのある低級アルキレン

50

基を示す。

Q は、酸素原子又は基 - S (O) n - (n は前記に同じ) を示す。

B₅ は、低級アルキレン基を示す。

B₆ は、低級アルキレン基を示す。

R^{1 9} は、水素原子又は低級アルカノイル基を示す。

B₇ は、低級アルキレン基を示す。

B₈ は、低級アルキレン基を示す。

B₉ は、低級アルキレン基を示す。

B₁₀ は、低級アルキレン基を示す。

B₁₁ は、低級アルキレン基を示す。

B_{23a} は、低級アルキレン基を示す。

l は、0 又は 1 を示す。

R^{1 4} は、水素原子又は置換基として水酸基を有することのあるアルキル基を示す。R¹

⁵ は、(2)水酸基置換アルキル基、(3)置換基として水酸基及び低級アルキル基なる群から

選ばれた基を有することのあるシクロアルキル基、(4)フェノキシ低級アルキル基、(5)フェ

ニル環上に低級アルキル基；置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコ

キシ基；ハロゲン原子；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ低級アル

コキシ基；水酸基置換低級アルキル基；フェニル低級アルキル基；低級アルキニル基；置

換基として低級アルキルスルホニル基を有することのあるアミノ基；低級アルキルチオ基

；シクロアルキル基；フェニルチオ基；アダマンチル基；フェニル環上に置換基としてハ

ロゲン原子を有することのあるアニリノ基；低級アルコキシカルボニル基；ピペラジン環

上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペラジニル基；ピロリジン環上

に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニル基；低級アルカノイルアミノ基；

シアノ基；及びフェノキシ基なる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよいフェニ

ル基、(6)フェノキシ基、(7)フェニル環上にハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を

有することのある低級アルコキシ基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個

置換していてもよいフェニル低級アルキル基、(8)フェニル環上に置換基として低級アル

キレンジオキシ基を有するフェニル低級アルキル基、(10)低級アルコキシカルボニル置換

低級アルキル基、(11)カルボキシ置換低級アルキル基、(12)置換基として低級アルカノ

イル基を有することのあるアミノ基、(13)テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキソ

基、低級アルコキシ基及び低級アルキレンジオキシ基なる群から選ばれた基を 1 ~ 3 個有

することのある 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル基、(14)シクロアルキル低級アル

キル基、(15)フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのある

フェニル低級アルキル基がピペラジン環上に置換していてもよいピペラジニル低級アルカ

ノイル基、(16)ピリジル低級アルキル基、(17)置換基として低級アルキル基及び低級アル

カノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基置換低級アルキル基、(18)

低級アルコキシ低級アルキル基、(19)イミダゾリル基、(20)イミダゾリル低級アルキル基

、(21) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリルカルボニル置換低級アルキル基、(22)

ピペリジン環上に置換基として低級アルコキシカルボニル基、フェニル低級アルキル基及

びフリル低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピペリジニルカルボ

ニル基、(23)チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニル

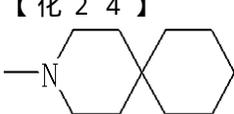
低級アルカノイル基、(24)ピペリジン環上に低級アルコキシカルボニル基、フェニル低級

アルキル基、低級アルキル基、ベンゾイル基及びフリル低級アルキル基なる群から選ば

れた基が置換していてもよいピペリジニル基、(25)基

【 0 0 7 0 】

【 化 2 4 】



【 0 0 7 1 】

10

20

30

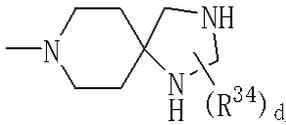
40

50

が置換したカルボニル低級アルキル基、(26)基

【0072】

【化25】



【0073】

が置換したカルボニル低級アルキル基、(27)基 - CO - B₂₀ - N(R³⁶)R³⁷、(26a)ピロリジニル低級アルキル基、(27a)モルホリノ低級アルキル基、(28a)フェニル低級アルケニル基、(29a)フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノカルボニル低級アルキル基、(30a)インドリル基、(31a)ピペラジン環上に置換基として低級アルキル基及びフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピペラジニル低級アルキル基、(32a)置換基として低級アルキル基を有することのあるアミジノ低級アルキル基、(33a)フルオレニル基、(34a)カルバゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるカルバゾリル基、(35a)置換基として低級アルキル基を有することのあるアミジノ基、(36a)ピペラジン環上に置換基としてフェニル低級アルキル基(フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基及び低級アルコキシ基なる群から選ばれた基1~3個有していてもよい)及びピリジル低級アルキル基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるピペラジニル置換オキサリル基又は(37a)シアノ置換低級アルキル基を示す。

10

20

30

50

R³⁴は、オキソ基又はフェニル基を示す。

dは、0~3の整数を示す。

B₂₀は、低級アルキレン基を示す。

R³⁶及びR³⁷は、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成される5~7員の飽和複素環基を示す。該複素環基上には、フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基が1~3個置換していてもよい。

R¹⁴とR¹⁵とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5~10員の飽和又は不飽和複素環；或いは基

【0074】

【化26】



【0075】

を形成してもよい。該複素環上には、(28)フェニル環上に置換基として低級アルカノイル基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基及び低級アルキレンジオキシ基なる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよいフェニル基を1~2個有し、低級アルキル基上にピリジル基を有することのあるフェニル置換低級アルキル基、(29)カルバモイル基、(30)ピリジン環上に置換基として水酸基及び置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるピリジル低級アルキル基、(31)ピロール環上に置換基として低級アルキル基を1~3個有することのあるピロリル低級アルキル基、(32)ベンゾオキサゾリル低級アルキル基、(33)ベンゾチアゾリル低級アルキル基、(34)フリル低級アルキル基、(35)フェニル環上にシアノ基、置換基として低級

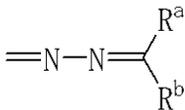
40

50

アルキルスルホニル基を有することのあるアミノ基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニル低級アルキル基、チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニリデン低級アルキル基及び低級アルキレンジオキシ基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよいベンゾイル基、(36)ピリジニル基、(37)ピラジニル基、(38)ピリジル基、(39)低級アルコキシカルボニル基、(40)チアゾリジン環上にオキソ基及び基

【0076】

【化27】



【0077】

(R^a及びR^bは、それぞれ低級アルキル基を示す。)なる群より選ばれた基が置換していてもよいチアゾリジニル低級アルカノイル基、(41)置換基として水酸基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのある低級アルキル基、(42)置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基、(43)フェニル環上に低級アルコキシ低級アルキル基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるカルバモイル基、低級アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、シアノ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルキル基及び水酸基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよいフェニル基、(44)フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有するフェニル基、(45)ナフチル低級アルキル基、(46)フェニル環上にシアノ基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基なる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよいフェノキシ基、(47)フェノキシ低級アルキル基、(48)フェニル環上にハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよいフェニル低級アルコキシ基、(49)基-(B₁₂CO)t-N(R²⁰)R²¹、(50)基-(CO)O-B₁₃-N(R²²)R²³、(51)1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン環上に置換基として低級アルキル基を1～5個有していてもよい1,2,3,4-テトラヒドロナフチル置換低級アルキル基、(52)置換基として水酸基を有することのあるシクロアルキル基、(53)ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を1～3個有していてもよいピペリジニル基、(54)キノリル低級アルキル基、(55)テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのある1,2,3,4-テトラゾリル低級アルキル基、(56)チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリル低級アルキル基、(57)フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基及びハロゲン原子なる群から選ばれる基を1～3個有することのあるベンゾイル低級アルキル基、(58)ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニル低級アルキル基、(59)イミダゾール環上に置換基としてフェニル基を1～3個有することのあるイミダゾリル基、(60)ベンズイミダゾール環上に置換基として低級アルキル基を1～3個有することのあるベンズイミダゾリル基、(61)ピリジル低級アルコキシ基、(62)テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキソ基を有することのある1,2,3,4-テトラヒドロキノリル低級アルキル基、(63)1,3,4-オキサジアゾール環上に置換基としてオキソ基を有することのある1,3,4-オキサジアゾリル低級アルキル基、(64)シクロアルキル低級アルキル基、(65)テトラヒドロピラニル基、(66)チエニル低級アルキル基、(67)ピリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピリジニルカルボニル基、(68)水酸基、(69)カルボキシ基、(70)低級アルコキシ低級アルキ

10

20

30

40

50

ル基、(71)低級アルコキシ低級アルコキシ基、(72)ベンゾイルオキシ基、(73)低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基、(74)カルボキシ低級アルコキシ基、(75)フェノキシ低級アルカノイル基、(76)テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキシ基を有することのある1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリルカルボニル基、(77)フェニルスルホニル基、(78)イミダゾリル低級アルカノイル基、(79)イミダゾリル低級アルキル基、(80)ピリジルカルボニル基、(81)イミダゾリルカルボニル基、(82)低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、(83)カルボキシ低級アルキル基、(84)基 - (O - B₁₅)_s - CO - N(R²⁶)R²⁷、(85)基 - N(R²⁸) - CO - B₁₆ - N(R²⁹)R³⁰、(86)基 - N(R³¹) - B₁₇ - CO - N(R³²)R³³、(87)ベンゾオキサゾリル基、(88a)ベンゾチエニル基、(89a)オキシ基及び(90a)テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキシ基を有することのある1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基なる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよい。

B₁₂は、低級アルキレン基を示す。

tは、0又は1を示す。

R²⁰及びR²¹は、同一又は異なって、水素原子；置換基として低級アルコキシカルボニル基を有することのあるアミノ基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を1~3個有することのあるベンゾイル基；低級アルキル基；フェニル環上に低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基及び低級アルキルチオ基なる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよいフェニル基を1~2個有する低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよいフェニル基；低級アルコキシカルボニル基；シクロアルキル低級アルキル基；ピロリジン環上に置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基を1~3個有することのあるピロリジニル低級アルキル基；置換基としてフェニル基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基；1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上に置換基として低級アルキル基を1~5個有していてもよい1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチル置換低級アルキル基；ナフチル低級アルキル基；ピリジル低級アルキル基；キノリル低級アルキル基；テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基を1~3個有することのある1, 2, 3, 4-テトラゾリル低級アルキル基；1, 2, 4-トリアゾリル低級アルキル基；低級アルキル基上に置換基として水酸基を有することのあるテトラヒドロフリル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びニトロ基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるフェノキシ低級アルキル基；フェニル低級アルカノイル基；置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基；イミダゾリル低級アルカノイル基；低級アルコキシカルボニル低級アルキル基；ピリジル基；カルボキシ低級アルキル基又はシクロアルキル基を示す。また、R²⁰とR²¹とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5~7員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子及びハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるフェニル基並びにフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよい。

oは、0又は1を示す。

B₁₃は、低級アルキレン基を示す。

R²²及びR²³は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を1~3個有することのあるベンゾイル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基、フェニル低級アルキル基又はフェニル基を示す。また、R²²とR²³とは、これらが結合する窒素

10

20

30

40

50

原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、低級アルキル基及びフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい。

B_{15} は、低級アルキレン基を示す。

s は、0又は1を示す。

R^{26} 及び R^{27} は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、フェニル低級アルキル基又はイミダゾリル低級アルキル基を示す。また、 R^{26} と R^{27} とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基を1～3個有していてもよい。

R^{28} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

B_{16} は、低級アルキレン基を示す。

R^{29} 及び R^{30} は、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成される5～7員の飽和複素環基を示す。該複素環上には、低級アルキル基、フェニル基及びフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい。

R^{31} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

B_{17} は、低級アルキレン基を示す。

R^{32} 及び R^{33} は、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成される5～7員の飽和複素環基を示す。該複素環上には、低級アルキル基、フェニル基及びフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよい。

【0078】

但し、下記(i)～(v)の要件を満たしているものとする。

【0079】

(i) X_1 が基 - CH = を示すとき、 R^3 は水素原子を示す。

【0080】

(ii) X_1 が基 - CH = を示し、 l が1を示し、 T が - CO - を示し、かつ R^{14} が水素原子又は置換基として水酸基を有することのあるアルキル基を示すとき、 R^{15} は基(24)を示す。

【0081】

(iii) X_1 が基 - CH = を示し、 l が1を示し、かつ T が - N(R^{17}) - B_3 - CO - を示すとき、 R^{14} 及び R^{15} は、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～10員の飽和又は不飽和複素環を形成し、かつ該複素環上には、基(28)が1～3個置換されている。

【0082】

(iv) X_1 が窒素原子を示しかつ l が0であるとき、又は X_1 が窒素原子を示し、 l が1であり、かつ T が - CO - もしくは - SO₂ を示すとき、 R^{15} は、基(5)、(7)、(19)及び(20)ではない。

【0083】

(v) R^6 がシクロアルキル環上に低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよいシクロアルキル基を示すとき、 R^4 は基 - (T)₁ - N(R^{14}) R^{15} を示すものとする。(T及び l は、前記に同じ。 R^{14} 及び R^{15} は、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～10員の飽和複素環；或いは基

10

20

30

40

50

【 0 0 8 4 】

【 化 2 8 】



【 0 0 8 5 】

を形成する。)]

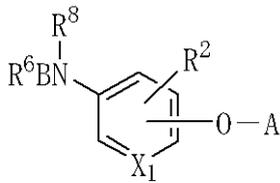
で表される芳香族化合物又はその塩。

【 0 0 8 6 】

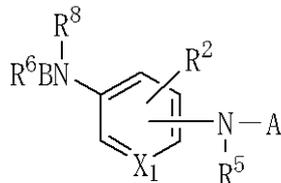
項 2 : 下記一般式 (1 - 1) ~ 一般式 (1 - 7) で表される化合物からなる群から選ば
れる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。 10

【 0 0 8 7 】

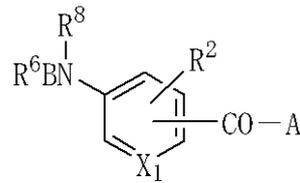
【 化 2 9 】



(1-1)

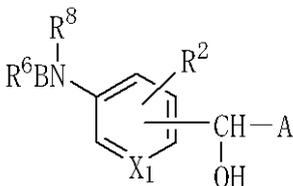


(1-2)

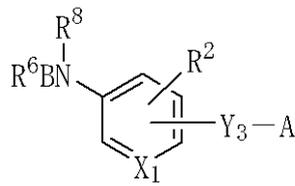


(1-3)

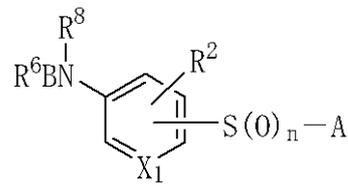
20



(1-4)

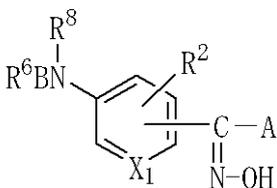


(1-5)



(1-6)

30



(1-7)

【 0 0 8 8 】

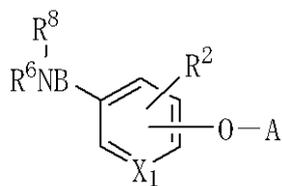
[式中、Y₃ は、低級アルキレン基を示す。]

項 3 : 下記一般式 (1 - 8) ~ 一般式 (1 - 1 4) で表される化合物からなる群から選
ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。 40

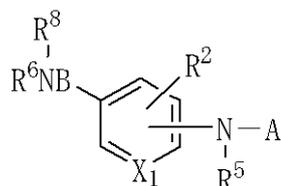
【 0 0 8 9 】

40

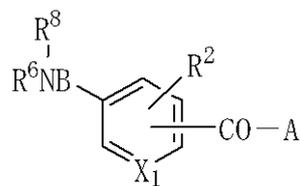
【化 3 0】



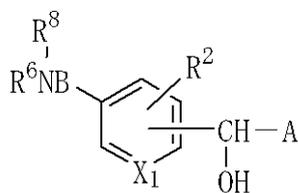
(1-8)



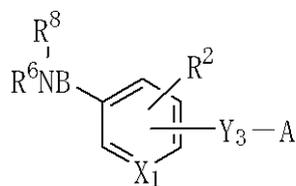
(1-9)



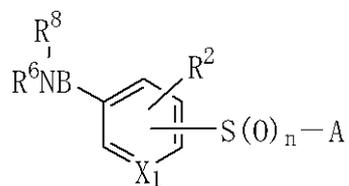
(1-10)



(1-11)

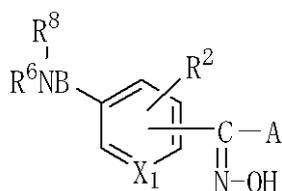


(1-12)



(1-13)

10



(1-14)

20

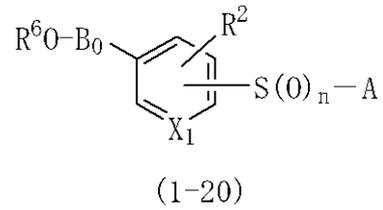
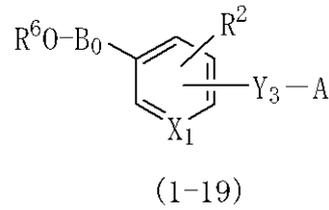
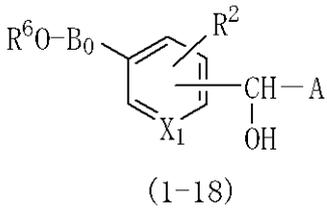
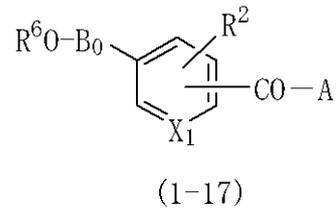
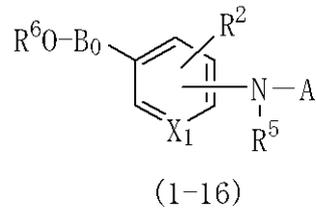
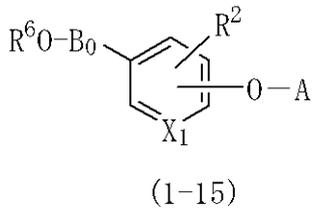
【 0 0 9 0】

[式中 Y₃ は、低級アルキレン基を示す。]

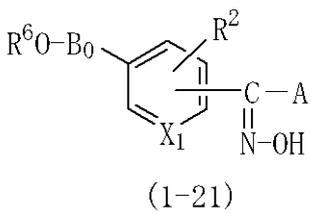
項 4：下記一般式(1-15)～一般式(1-21)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 0 9 1】

【化 3 1】



10



20

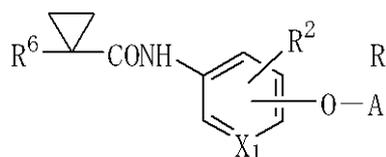
【 0 0 9 2 】

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

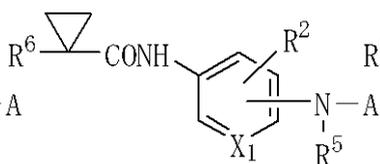
項 5 : 下記一般式 (1 - 2 2) ~ 一般式 (1 - 2 8) で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 0 9 3 】

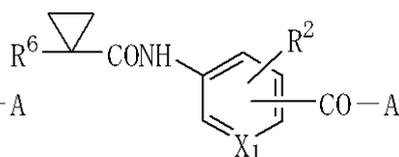
【化 3 2】



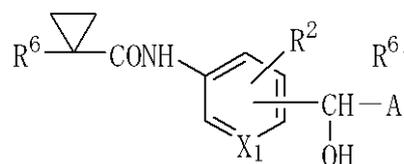
(1-22)



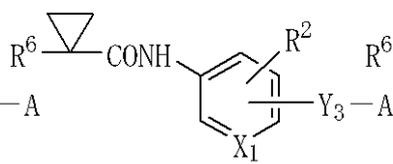
(1-23)



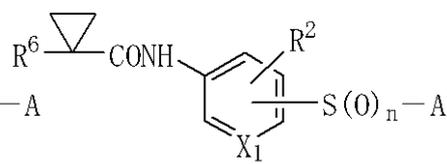
(1-24)



(1-25)

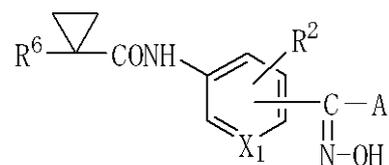


(1-26)



(1-27)

10



(1-28)

20

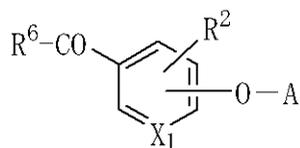
【 0 0 9 4 】

[式中、Y₃ は、低級アルキレン基を示す。]

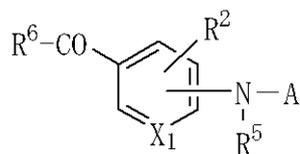
項 6 : 下記一般式 (1 - 2 9) ~ 一般式 (1 - 3 5) で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 0 9 5 】

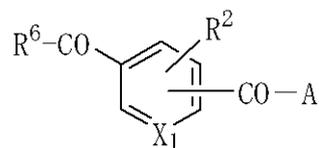
【化 3 3】



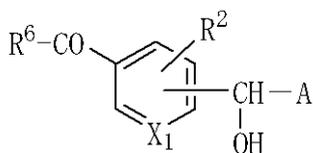
(1-29)



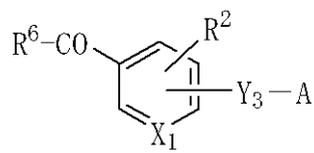
(1-30)



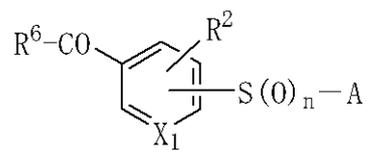
(1-31)



(1-32)

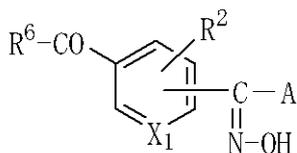


(1-33)



(1-34)

10



(1-35)

20

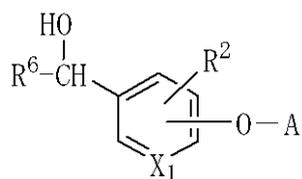
【 0 0 9 6 】

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

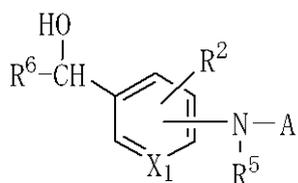
項 7 : 下記一般式 (1 - 3 6) ~ 一般式 (1 - 4 2) で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 0 9 7 】

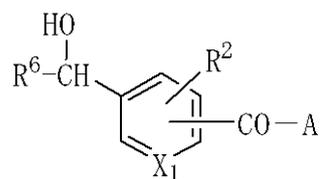
【化 3 4】



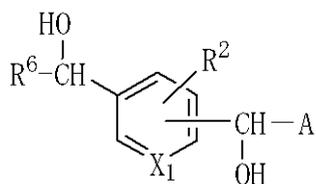
(1-36)



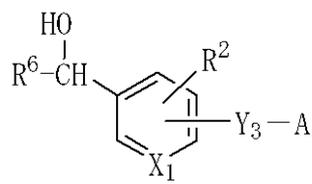
(1-37)



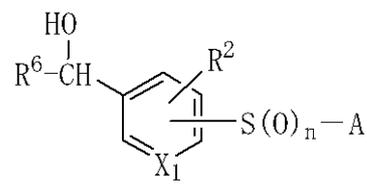
(1-38)



(1-39)

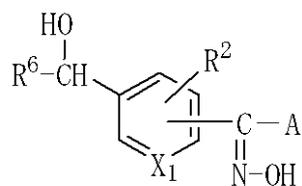


(1-40)



(1-41)

10



(1-42)

20

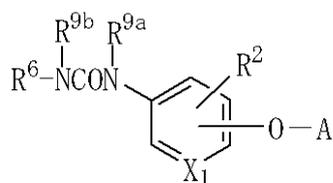
【 0 0 9 8】

[式中、Y₃ は、低級アルキレン基を示す。]

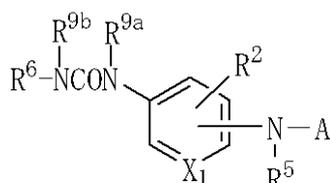
項 8 : 下記一般式 (1 - 4 3) ~ 一般式 (1 - 4 9) で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 0 9 9】

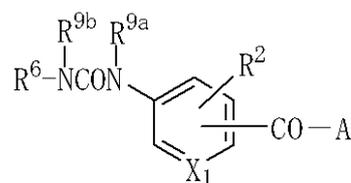
【化 3 5】



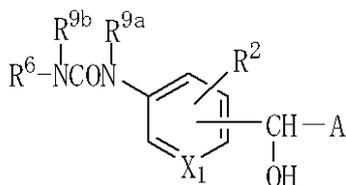
(1-43)



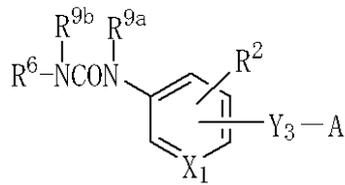
(1-44)



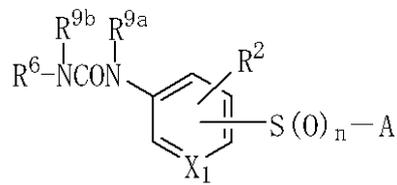
(1-45)



(1-46)

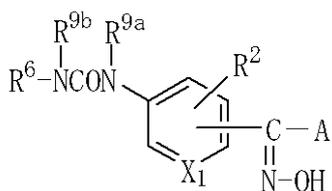


(1-47)



(1-48)

10



(1-49)

20

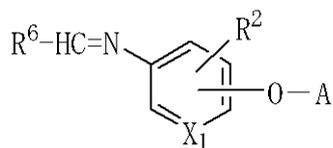
【 0 1 0 0 】

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

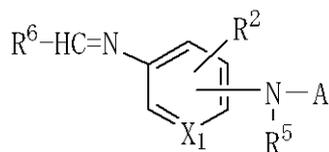
項 9：下記一般式(1-50)～一般式(1-56)で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 1 0 1 】

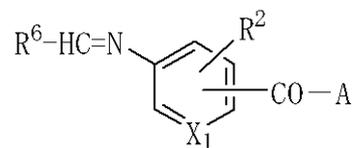
【化 3 6】



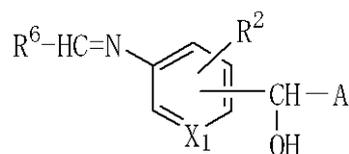
(1-50)



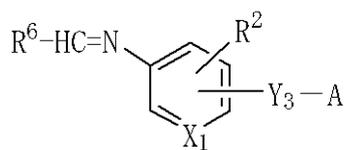
(1-51)



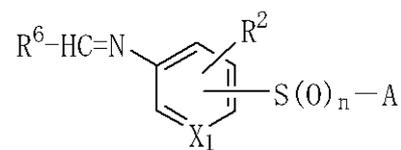
(1-52)



(1-53)

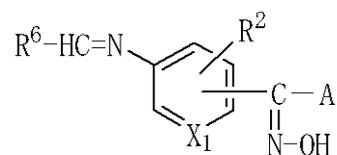


(1-54)



(1-55)

10



(1-56)

20

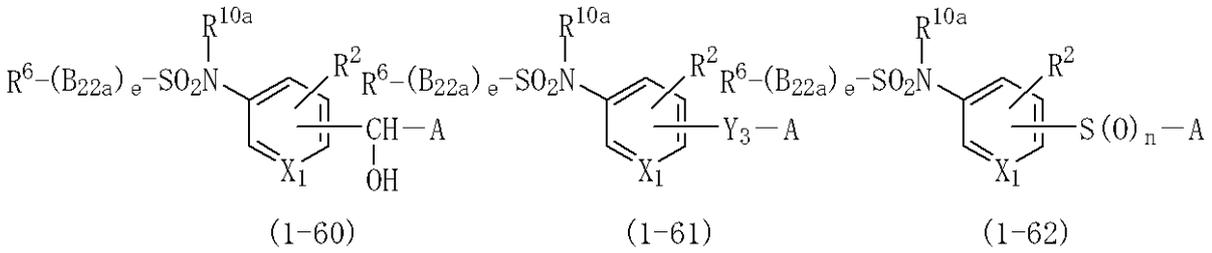
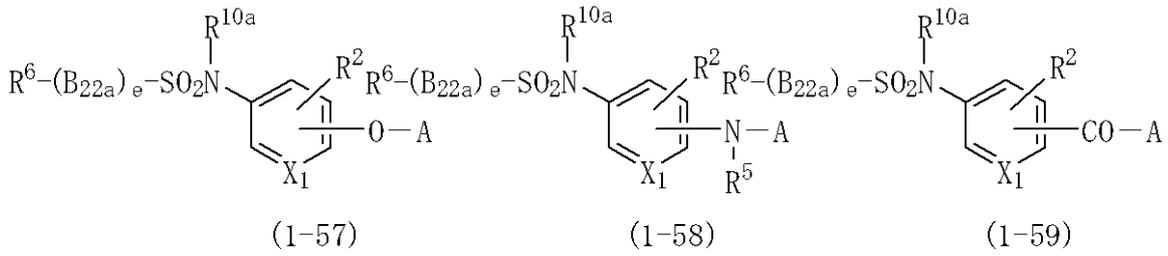
【 0 1 0 2 】

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

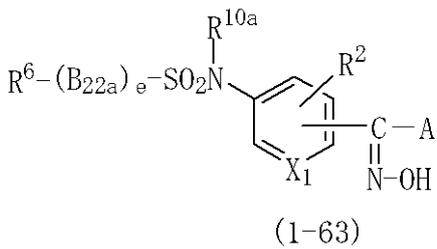
項 10 : 下記一般式 (1 - 5 7) ~ 一般式 (1 - 6 3) で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 1 0 3 】

【化 3 7】



10



20

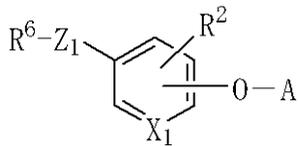
【 0 1 0 4 】

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

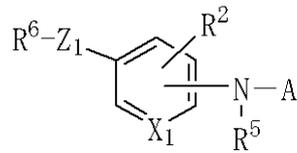
項 1 1 : 下記一般式 (1 - 6 4) ~ 一般式 (1 - 7 0) で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 1 0 5 】

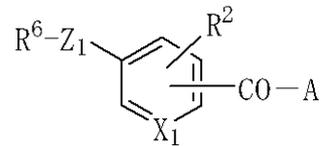
【化 3 8】



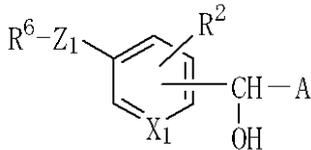
(1-64)



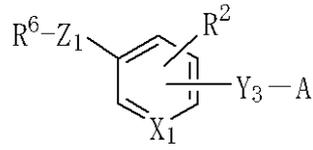
(1-65)



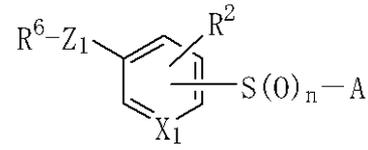
(1-66)



(1-67)

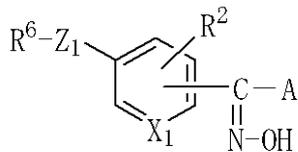


(1-68)



(1-69)

10



(1-70)

20

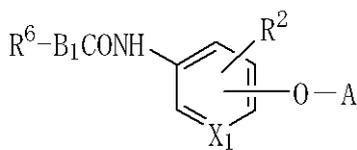
【0106】

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示し、 Z_1 は、低級アルケニレン基を示す。]

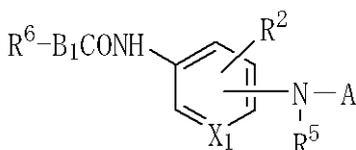
項 1 2 : 下記一般式 (1 - 7 1) ~ 一般式 (1 - 7 7) で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

【0107】

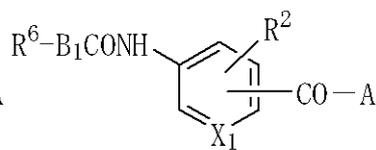
【化 3 9】



(1-71)

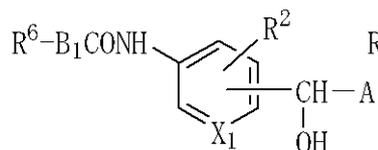


(1-72)

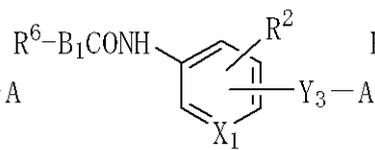


(1-73)

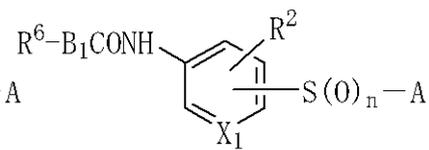
30



(1-74)

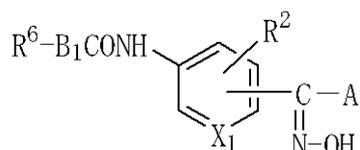


(1-75)



(1-76)

40



(1-77)

50

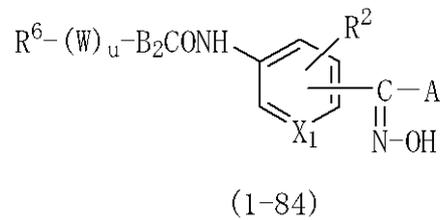
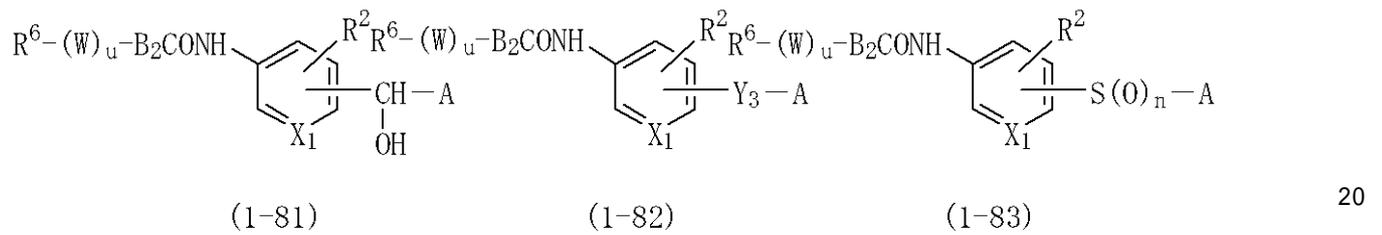
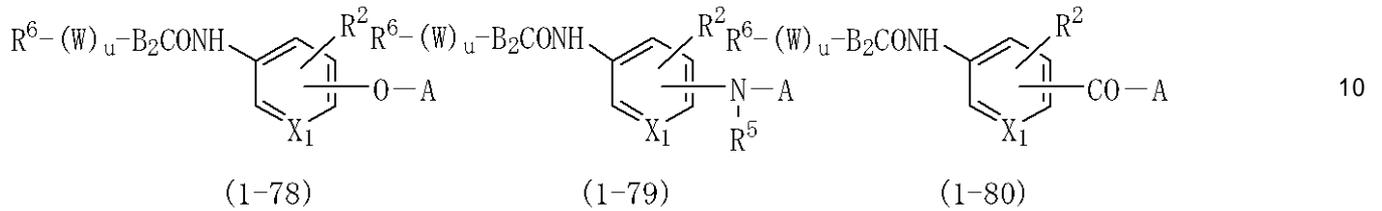
【 0 1 0 8 】

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

項 1 3 : 下記一般式 (1 - 7 8) ~ 一般式 (1 - 8 4) で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 1 0 9 】

【 化 4 0 】



【 0 1 1 0 】

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

項 1 4 : 下記一般式 (1 - 8 5) ~ 一般式 (1 - 9 1) で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

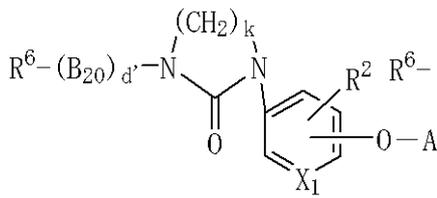
【 0 1 1 1 】

10

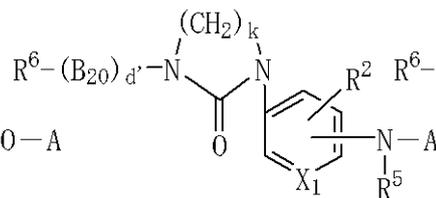
20

30

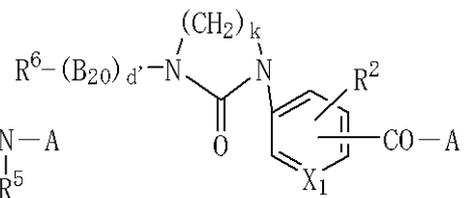
【化 4 2】



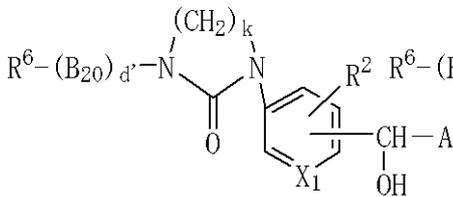
(1-92)



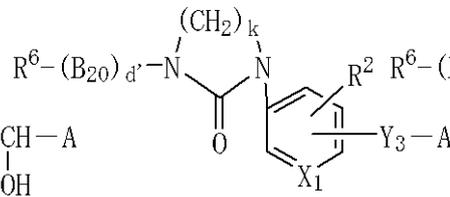
(1-93)



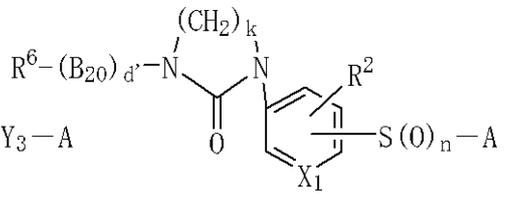
(1-94)



(1-95)

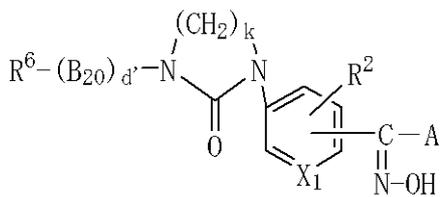


(1-96)



(1-97)

10



(1-98)

20

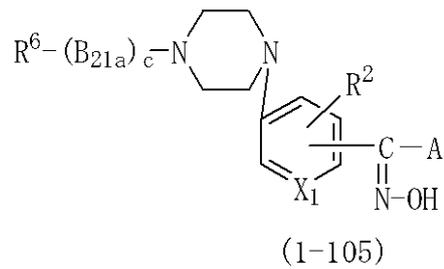
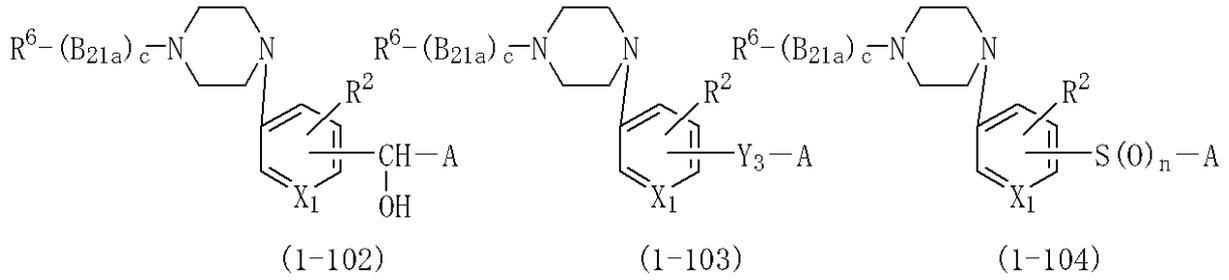
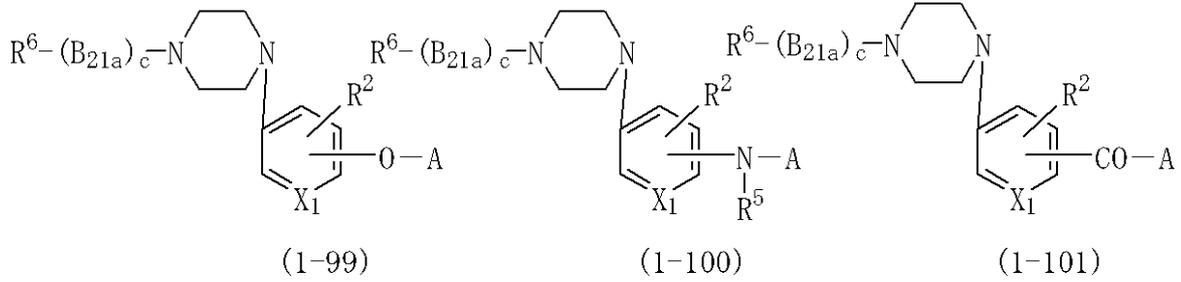
【 0 1 1 4 】

[式中、Y₃ は、低級アルキレン基を示す。]

項 16 : 下記一般式 (1 - 9 9) ~ 一般式 (1 - 1 0 5) で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 1 1 5 】

【化 4 3】



【 0 1 1 6 】

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

項 17 : 下記一般式 (1 - 1 0 6) ~ 一般式 (1 - 1 1 2) で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

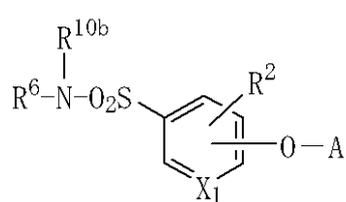
【 0 1 1 7 】

10

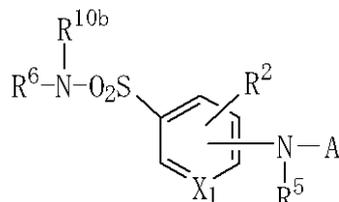
20

30

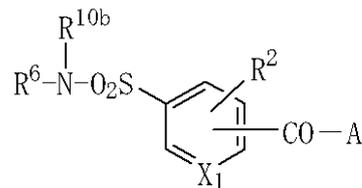
【化 4 4】



(1-106)

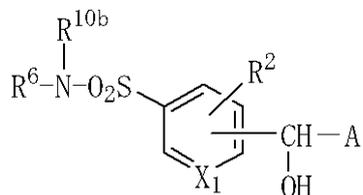


(1-107)

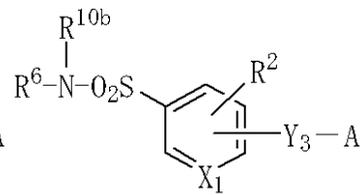


(1-108)

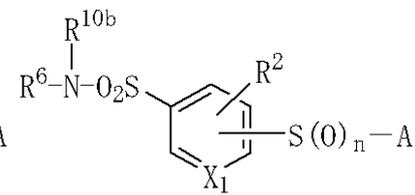
10



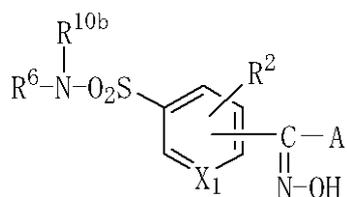
(1-109)



(1-110)



(1-111)



(1-112)

20

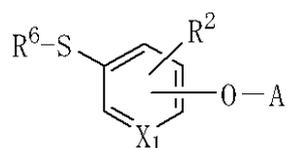
【 0 1 1 8 】

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

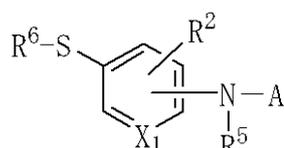
項 18 : 下記一般式 (1 - 1 1 3) ~ 一般式 (1 - 1 1 9) で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 1 1 9 】

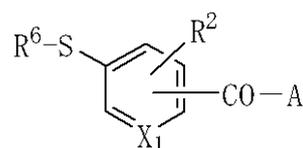
【化 4 5】



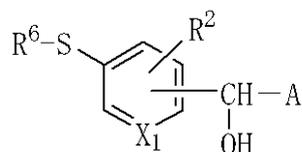
(1-113)



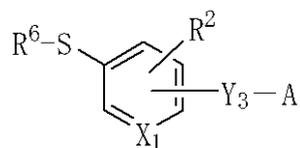
(1-114)



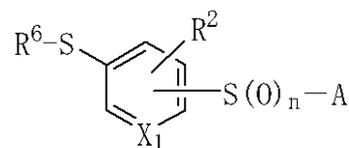
(1-115)



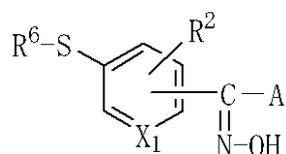
(1-116)



(1-117)



(1-118)



(1-119)

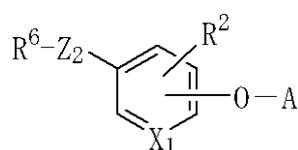
【 0 1 2 0 】

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

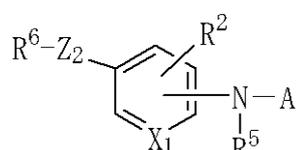
項 19 : 下記一般式 (1 - 1 2 0) ~ 一般式 (1 - 1 2 6) で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 1 2 1 】

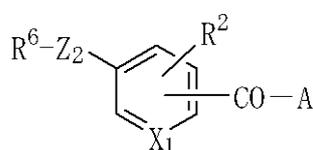
【化 4 6】



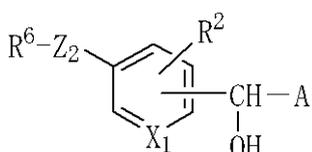
(1-120)



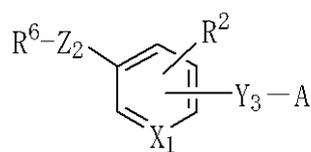
(1-121)



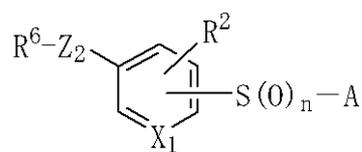
(1-122)



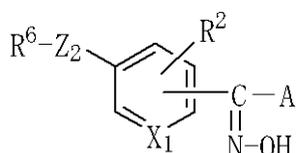
(1-123)



(1-124)



(1-125)



(1-126)

10

20

30

40

50

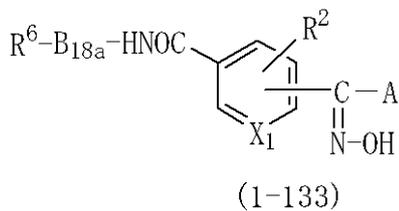
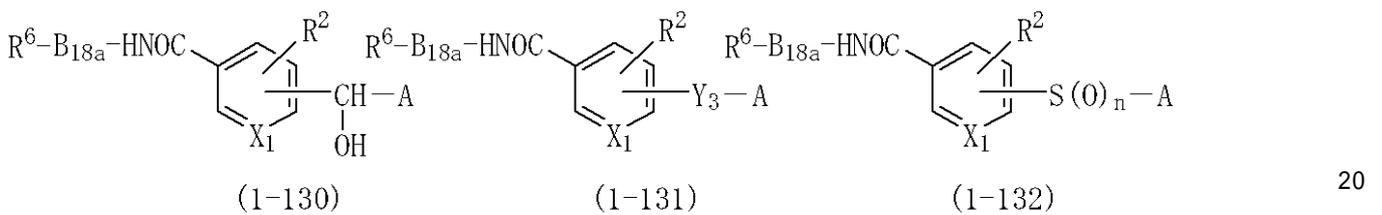
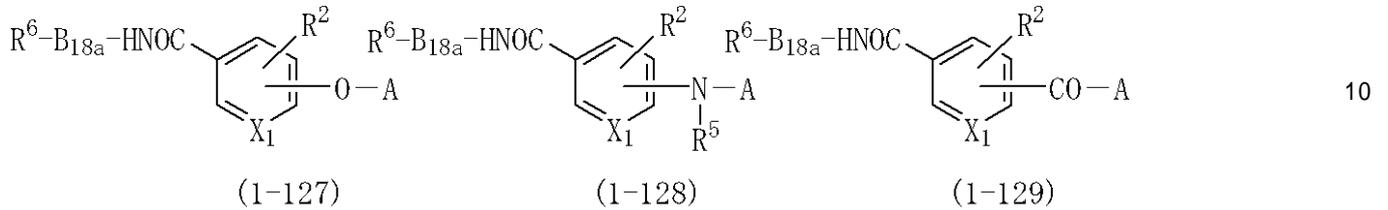
【 0 1 2 2 】

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示し、 Z_2 は、低級アルキニレン基を示す。]

項 2 0 : 下記一般式 (1 - 1 2 7) ~ 一般式 (1 - 1 3 3) で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 1 2 3 】

【 化 4 7 】



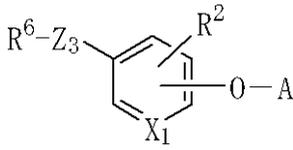
【 0 1 2 4 】

[式中、 Y_3 は、低級アルキレン基を示す。]

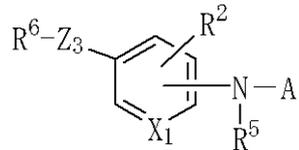
項 2 1 : 下記一般式 (1 - 1 3 4) ~ 一般式 (1 - 1 4 0) で表される化合物からなる群から選ばれる化合物又はその塩を有効成分として含む、項 1 に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 1 2 5 】

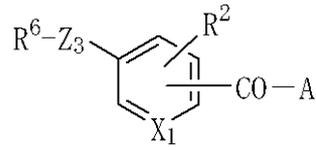
【化 4 8】



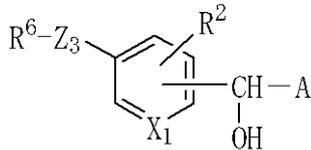
(1-134)



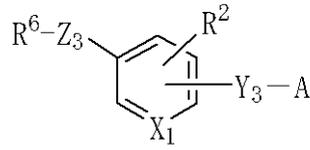
(1-135)



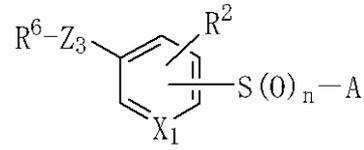
(1-136)



(1-137)

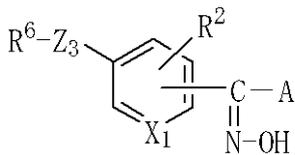


(1-138)



(1-139)

10



(1-140)

20

【 0 1 2 6】

[式中、Y₃ は、低級アルキレン基を示し、Z₃ は、低級アルキレン基又は基 - N (R⁸) - を示す。]

項 2 2 : Y が基 - O - を示す、上記 1 ~ 2 1 項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 1 2 7】

項 2 3 : Y が基 - N (R⁵) - を示す、上記 1 ~ 2 1 項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

30

【 0 1 2 8】

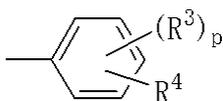
項 2 4 : Y が基 - CO - 、基 - CH (OH) - 、低級アルキレン基、基 - S (O) n - 又は基 - C (= N - OH) - を示す、上記 1 ~ 2 1 項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 1 2 9】

項 2 5 : A が基

【 0 1 3 0】

【化 4 9】



40

【 0 1 3 1】

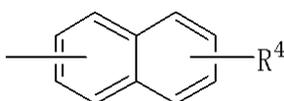
を示す、上記 1 ~ 2 1 項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

【 0 1 3 2】

項 2 6 : A が基

【 0 1 3 3】

【化 5 0】



50

【0134】

を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

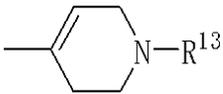
【0135】

項27：R⁴がイミダゾリル低級アルキル基、1,2,4-トリアゾリル低級アルキル基、1,2,3-トリアゾリル低級アルキル基、1,2,5-トリアゾリル低級アルキル基、ピラゾリル低級アルキル基、ピリミジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピリミジニル低級アルキル基、3,5-ジオキソイソキサゾリジン-4-イリデン低級アルキル基、1,2,4-オキサジアゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのある1,2,4-オキサジアゾリル低級アルキル基、チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニル低級アルキル基、基

10

【0136】

【化51】

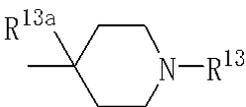


【0137】

又は基

【0138】

【化52】



20

【0139】

を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

【0140】

項28：R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵(T、R¹⁴及びR¹⁵は上記に同じ)を示し、lが0を示す一般式(1)で表される、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

【0141】

項29：R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵を示し、lが1を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

30

【0142】

項30：R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵を示し、lが1を示し、Tが基-N(R¹⁷)-B₃-CO-を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

【0143】

項31：R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵を示し、lが1を示し、Tが基-B₁₉-N(R¹⁸)-CO-を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

【0144】

項32：R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵を示し、lが1を示し、Tが基-B₄-CO-を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

40

【0145】

項33：R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵を示し、lが1を示し、Tが基-Q-B₅-CO-を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

【0146】

項34：R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵を示し、lが1を示し、Tが基-B₆-N(R¹⁹)-B₇-を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

50

【0147】

項35：R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵を示し、lが1を示し、Tが基-CO-B₈-を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

【0148】

項36：R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵を示し、lが1を示し、Tが基-H(OH)-B₉-を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

【0149】

項37：R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵を示し、lが1を示し、Tが基-CO-B₁₀-CO-を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

10

【0150】

項38：R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵を示し、lが1を示し、Tが基-H(OH)-B₁₁-CO-を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

【0151】

項39：R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵を示し、lが1を示し、Tが基-CO-を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

【0152】

項40：R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵を示し、lが1を示し、Tが基-SO₂-を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

20

【0153】

項41：R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵を示し、lが1を示し、Tが基-B_{23a}-CO-CO-を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

【0154】

項42：R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵を示し、lが1を示し、Tが低級アルキレン基を示す、上記1～21項のいずれか一項に記載の芳香族化合物又はその塩。

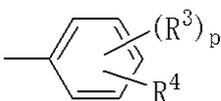
【0155】

項43：一般式(1-1)、(1-2)、(1-8)、(1-9)、(1-15)、(1-16)、(1-29)、(1-30)、(1-43)、(1-44)、(1-57)、(1-58)、(1-64)及び(1-65)なる群から選ばれた化合物又はその塩[式中、Yが基-O-又は基-N(R⁵)-、Aが基

30

【0156】

【化53】



【0157】

を示し、R⁴が基-(T)₁-N(R¹⁴)R¹⁵を示す]を有効成分として含む、上記1項記載の芳香族化合物又はその塩。

40

【0158】

項44：lが1を示し、Tが基-N(R¹⁷)-B₃-CO-を示す、上記43項記載の芳香族化合物又はその塩。

【0159】

項45：lが1を示し、Tが基-B₄-CO-を示す、上記43項記載の芳香族化合物又はその塩。

【0160】

項46：lが1を示し、Tが基-CO-を示す、上記43項記載の芳香族化合物又はその塩。

50

- ジクロロベンズアミド、1 - (6 - { 4 - [3 - (4 - ピペロニルピペラジン - 1 - イル) - 3 - オキソプロピル] フェノキシ } ピリジン - 3 - イル) - 3 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) - 1 - エチル尿素、N - (6 - { 4 - [3 - (4 - ピペロニルピペラジン - 1 - イル) - 3 - オキソプロピル] フェノキシ } ピリジン - 3 - イル) - 4 - トリフルオロメチルベンズアミド、N - [6 - (4 - { [2 - (4 - ベンジルピペラジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル] メチルアミノ } - 2 - メチルフェノキシ) ピリジン - 3 - イル] - 4 - トリフルオロメチルベンズアミド、N - [6 - (4 - { 4 - [2 - (4 - ベンジルピペラジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル] ピペリジン - 1 - イル } フェノキシ) ピリジン - 3 - イル] - 3 , 4 - ジクロロベンズアミド、N - (6 - { 4 - [3 - (4 - ピペロニルピペラジン - 1 - カルボニル) ピペリジン - 1 - イル] フェノキシ } ピリジン - 3 - イル) - 3 , 4 - ジクロロベンズアミド、N - [6 - (4 - { 4 - [2 - (4 - ベンジルピペラジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル] ピペリジン - 1 - イル } フェノキシ) ピリジン - 3 - イル] - 4 - トリフルオロメチルベンズアミド、N - { 6 - [(4 - { 4 - [2 - (4 - ベンジルピペラジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル] ピペリジン - 1 - イル } フェニル) メチルアミノ] ピリジン - 3 - イル } - 4 - トリフルオロメチルベンズアミド、N - (6 - { 4 - [(2 - { 4 - [4 - (4 - フルオロベンゾイル) フェニル] ピペラジン - 1 - イル } - 2 - オキソエチル) メチルアミノ] - 2 - メトキシフェノキシ } ピリジン - 3 - イル) - 4 - トリフルオロメチルベンズアミド、2 - (4 - ピペロニルピペラジン - 1 - イル) - N - { 3 - メチル - 4 - [5 - (4 - トリフルオロメチルフェノキシメチル) ピリジン - 2 - イルオキシ] フェニル } - 2 - オキソアセトアミド、N - [6 - (4 - { [2 - (4 - ピペロニルピペラジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル] メチルアミノ } - 2 - メチルフェノキシ) ピリジン - 3 - イル] - 2 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチルベンズアミド、N - [6 - (4 - { 4 - [2 - (4 - ピペロニルピペラジン - 1 - イル) - 2 - オキソエチル] ピペリジン - 1 - イル } - 2 - メトキシフェノキシ) ピリジン - 3 - イル] - 4 - トリフルオロメチルベンズアミド及び 4 - (3 - { 3 - メチル - 4 - [5 - (4 - トリフルオロメチルベンゾイルアミノ) ピリジン - 2 - イルオキシ] フェニル } - 2 - オキソヘキサヒドロピリミジン - 1 - イル) 安息香酸エチルエステルからなる群から選ばれた化合物又はその塩を有効成分として含む、上記 1 記載の芳香族化合物又はその塩。

10

20

30

【 0 1 6 3 】

本発明の有効成分である芳香族化合物又はその塩は、公知の化合物であり、特許文献 1 に記載されている。

【 0 1 6 4 】

前記一般式 (1) において示される各基は、具体的には次の通りである。

低級アルケニレン基としては、例えば、ビニレン、1 - プロペニレン、1 - メチル - 1 - プロペニレン、2 - メチル - 1 - プロペニレン、2 - プロペニレン、2 - ブテニレン、1 - ブテニレン、3 - ブテニレン、2 - ペンテニレン、1 - ペンテニレン、3 - ペンテニレン、4 - ペンテニレン、1 , 3 - ブタジエニレン、1 , 3 - ペンタジエニレン、2 - ペンテン - 4 - イニレン、2 - ヘキセニレン、1 - ヘキセニレン、5 - ヘキセニレン、3 - ヘキセニレン、4 - ヘキセニレン、3 , 3 - ジメチル - 1 - プロペニレン、2 - エチル - 1 - プロペニレン、1 , 3 , 5 - ヘキサトリエニレン、1 , 3 - ヘキサジエニレン、1 , 4 - ヘキサジエニレン基等の二重結合を 1 ~ 3 個有する炭素数 2 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルケニレン基を例示できる。

40

低級アルキニレン基としては、例えば、エチニレン、1 - プロピニレン、1 - メチル - 1 - プロピニレン、2 - メチル - 1 - プロピニレン、2 - プロピニレン、2 - ブチニレン、1 - ブチニレン、3 - ブチニレン、2 - ペンチニレン、1 - ペンチニレン、3 - ペンチニレン、4 - ペンチニレン、2 - ペンチン - 4 - イニレン、2 - ヘキシニレン、1 - ヘキシニレン、5 - ヘキシニレン、3 - ヘキシニレン、4 - ヘキシニレン、3 , 3 - ジエチル - 1 - プロピニレン、2 - エチル - 1 - プロピニレン基等の三重結合を 1 ~ 3 個有する炭素数 2 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキニレン基を例示できる。

50

【 0 1 6 5 】

低級アルコキシ基としては、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、tert-ブトキシル、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を挙げることができる。

【 0 1 6 6 】

低級アルキル基としては、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ブチル、イソブチル、tert-ブチル、イソペンチル、ペンチル、ヘキシル基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を挙げることができる。

【 0 1 6 7 】

置換基として低級アルコキシ基を有することのある低級アルキル基としては、例えば、前記低級アルキル基に加えて、メトキシメチル、1-エトキシエチル、2-メトキシエチル、2-プロポキシエチル、3-イソプロポキシプロピル、4-ブトキシブチル、5-ペンチルオキシペンチル、6-ヘキシルオキシヘキシル、1,1-ジメチル-2-メトキシエチル、2-メチル-3-エトキシプロピル、3-メトキシプロピル基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【 0 1 6 8 】

低級アルカノイル基としては、例えば、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ペンタノイル、tert-ブチルカルボニル、ヘキサノイル基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基が挙げられる。

【 0 1 6 9 】

フェニル低級アルキル基としては、例えば、ベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、1,1-ジメチル-2-フェニルエチル、2-メチル-3-フェニルプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基を挙げることができる。

【 0 1 7 0 】

低級アルキレン基としては、例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、2-メチルトリメチレン、2,2-ジメチルエチレン、2,2-ジメチルトリメチレン、1-メチルトリメチレン、メチルメチレン、エチルメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキレン基を例示できる。

【 0 1 7 1 】

置換基としてフェニル基を有することのある低級アルケニレン基としては、例えば、ビニレン、1-プロペニレン、1-メチル-1-プロペニレン、2-メチル-1-プロペニレン、2-プロペニレン、2-ブテニレン、1-ブテニレン、3-ブテニレン、2-ペンテニレン、1-ペンテニレン、3-ペンテニレン、4-ペンテニレン、1,3-ブタジエニレン、1,3-ペンタジエニレン、2-ペンテン-4-イニレン、2-ヘキセニレン、1-ヘキセニレン、5-ヘキセニレン、3-ヘキセニレン、4-ヘキセニレン、3,3-ジメチル-1-プロペニレン、2-エチル-1-プロペニレン、1,3,5-ヘキサトリエニレン、1,3-ヘキサジエニレン、1,4-ヘキサジエニレン、1-フェニルビニレン、3-フェニル-1-プロペニレン、3-フェニル-1-メチル-1-プロペニレン、3-フェニル-2-メチル-1-プロペニレン、1-フェニル-2-プロペニレン、1-フェニル-2-ブテニレン、3-フェニル-1-ブテニレン、1-フェニル-3-ブテニレン、5-フェニル-2-ペンテニレン、4-フェニル-1-ペンテニレン、2-フェニル-3-ペンテニレン、1-フェニル-4-ペンテニレン、1-フェニル-1,3-ブタジエニレン、1-フェニル-1,3-ペンタジエニレン、1-フェニル-2-ペンテン-4-イニレン、1-フェニル-2-ヘキセニレン、3-フェニル-1-ヘキセニレン、4-フェニル-5-ヘキセニレン、6-フェニル-3-ヘキセニレン、5-フェニル-4-ヘキセニレン、1-フェニル-3,3-ジメチル-1-プロペニレン、1-フェニル-2

10

20

30

40

50

- エチル - 1 - プロピレン、6 - フェニル - 1, 3, 5 - ヘキサトリエニレン、1 - フェニル - 1, 3 - ヘキサジエニレン、2 - フェニル - 1, 4 - ヘキサジエニレン基等の二重結合を1 ~ 3個有する置換基としてフェニル基を有することのある炭素数2 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルケニレン基を例示できる。

【0172】

低級アルコキシ基及びフェニル基なる群から選ばれた基が置換していてもよい低級アルキレン基としては、例えば前記低級アルキレン基に加えて、メトキシメチレン、2 - フェニルエチレン、3 - エトキシトリメチレン、1 - プロポキシ - 2 - メチルトリメチレン、1 - フェニル - 2, 2 - ジメチルエチレン、3 - フェニル - 2, 2 - ジメチルトリメチレン、2 - ブトキシ - 1 - メチルトリメチレン、フェニルメチルメチレン、2 - ペンチルオキシエチルメチレン、4 - フェニル - 2 - ヘキシルオキシテトラメチレン、3 - フェニルペンタメチレン、5 - フェニルヘキサメチレン、エトキシメチレン、1 - フェニルエチレン基、3 - フェニルトリメチレン、2 - フェニル - 1 - メトキシエチレン基等の炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基及びフェニル基なる群から選ばれた基が1 ~ 2個置換していてもよい炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルキレン基を例示できる。

10

【0173】

窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1 ~ 4個有する5 ~ 15員の単環、二項環又は三項環の飽和又は不飽和複素環基としては、例えば、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリノ、ピリジル、1, 2, 5, 6 - テトラヒドロピリジル、1, 2, 4 - トリアゾリル、1, 2, 3 - トリアゾリル、1, 2, 5 - トリアゾリル、チアゾリジニル、1, 2, 3, 4 - テトラゾリル、チエニル、キノリル、1, 4 - ジヒドロキノリル、ベンゾチアゾリル、ピラジル、ピリミジル、ピリダジル、2H - ピロリル、ピロリル、1, 3, 4 - オキサジアゾリル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロフリル、フラザニル、カルボスチリル、3, 4 - ジヒドロカルボスチリル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリル、インドリル、イソインドリル、インドリニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、イミダゾリジニル、イソキノリル、キナゾリジニル、キノキサリニル、シンノリニル、フタラジニル、カルバゾイル、アクリジニル、クロマニル、イソインドリニル、イソクロマニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピラゾリジニル、フェノチアジニル、ベンゾフリル、2, 3 - ジヒドロベンゾ [b] フリル、ベンゾチエニル、フェノキサチイニル、フェノキサジニル、4H - クロメニル、1H - インダゾリル、フェナジニル、キサンテニル、チアントレニル、2 - イミダゾリニル、2 - ピロリニル、フリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、イソオキサゾリジニル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラニル、2 - チアゾリニル、2 - ピラゾリニル、キヌクリジニル、1, 4 - ベンゾオキサジニル、3, 4 - ジヒドロ - 2H - 1, 4 - ベンゾオキサジニル、3, 4 - ジヒドロ - 2H - 1, 4 - ベンチアジニル、1, 4 - ベンゾチアジニル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノキサリニル、1, 3 - ジチア - 2, 4 - ジヒドロナフタレニル、フェナントリジニル、1, 4 - ジチアナフタレニル、ジベンズ [b, e] アゼピン、6, 11 - ジヒドロ - 5H - ジベンズ [b, e] アゼピン基等が挙げられる。

20

30

【0174】

ハロゲン原子としては、弗素原子、塩素原子、臭素原子及び沃素原子が挙げられる。

40

【0175】

置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基としては、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、tert - ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、クロロメトキシ、プロモメトキシ、フルオロメトキシ、ヨードメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジプロモメトキシ、2 - クロロエトキシ、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、2, 2, 2 - トリクロロエトキシ、3 - クロロプロポキシ、2, 3 - ジクロロプロポキシ、4, 4, 4 - トリクロロブトキシ、4 - フルオロブトキシ、5 - クロロペンチルオキシ、3 - クロロ - 2 - メチルプロポキシ、6 - プロモヘキシルオキシ、5, 6 - ジクロロヘキシルオキシ基等の置換基としてハロゲン原子を1 ~ 3個有することのある炭素数1 ~ 6の直鎖又は分

50

枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0176】

置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基としては、前記低級アルキル基に加えて、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロメチル、プロモメチル、フルオロメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、ジプロモメチル、ジクロロメチル、2-クロロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、3-クロロプロピル、2, 3-ジクロロプロピル、4, 4, 4-トリクロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロペンチル、3-クロロ-2-メチルプロピル、5-プロモヘキシル、5, 6-ジプロモヘキシル基等の置換基としてハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

10

【0177】

低級アルキルスルホニル基としては、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、ブチルスルホニル、tert-ブチルスルホニル、ペンチルスルホニル、ヘキシルスルホニル基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基を挙げることができる。

【0178】

フェニル環上にハロゲン原子を有することのある低級アルキル基が置換していてもよいフェニル基としては、例えば、フェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2-エチルフェニル、3-エチルフェニル、4-エチルフェニル、4-イソプロピルフェニル、3-ブチルフェニル、4-ペンチルフェニル、4-ヘキシルフェニル、3, 4-ジメチルフェニル、3, 4-ジエチルフェニル、2, 4-ジメチルフェニル、2, 5-ジメチルフェニル、2, 6-ジメチルフェニル、3, 4, 5-トリメチルフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、2-(プロモメチル)フェニル、3-(2-クロロエチル)フェニル、4-(2, 3-ジクロロプロピル)フェニル、4-(4-フルオロブチル)フェニル、3-(5-クロロペンチル)フェニル、4-(5-プロモヘキシル)フェニル、4-(5, 6-ジプロモヘキシル)フェニル、3, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェニル、3, 4-ジ(4, 4, 4-トリクロロブチル)フェニル、2, 4-ジ(3-クロロ-2-メチルプロピル)フェニル、2, 5-ジ(3-クロロプロピル)フェニル、2, 6-ジ(2, 2, 2-トリフルオロエチル)フェニル、3, 4, 5-トリ(トリフルオロメチル)フェニル、4-(2, 2, 2-トリクロロエチル)フェニル、2-メチル-4-トリフルオロメチルフェニル、3-エチル-4-トリクロロメチル基等のフェニル環上にハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基が1~3個置換していてもよいフェニル基を例示できる。

20

30

【0179】

低級アルキルチオ基としては、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、tert-ブチルチオ、ペンチルチオ、ヘキシルチオ基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキルチオ基を挙げることができる。

【0180】

置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ、ジペンチルアミノ、ジヘキシルアミノ、N-メチル-N-エチルアミノ、N-エチル-N-プロピルアミノ、N-メチル-N-ブチルアミノ、N-メチル-N-ヘキシルアミノ、N-アセチルアミノ、N-ホルミルアミノ、N-プロピオニルアミノ、N-ブチリルアミノ、N-イソブチリルアミノ、N-ペンタノイルアミノ、N-tert-ブチルカルボニルアミノ、N-ヘキサノイルアミノ、ジアセチルアミノ、N-アセチル-N-メチルアミノ、N-アセチル-N-エチルアミノ基等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基なる群から選ばれた

40

50

基を1～2個有することのあるアミノ基を例示できる。

【0181】

ナフタレン環上に低級アルキル基、ハロゲン原子並びに置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよいナフチル基としては、例えば、(1-又は2-)ナフチル、1-メチル-(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-)ナフチル、2-エチル-(1-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-)ナフチル、3-n-プロピル-(1-、2-、4-、5-、6-、7-又は8-)ナフチル、4-n-ブチル-(1-、2-、3-、5-、6-、7-又は8-)ナフチル、4-メチル-(1-、2-、3-、5-、6-、7-又は8-)ナフチル、5-n-ペンチル-(1-、2-、3-、4-、6-、7-又は8-)ナフチル、6-n-ヘキシル-(1-、2-、3-、4-、5-、7-又は8-)ナフチル、1,7-ジメチル-(2-、3-、4-、5-、6-又は8-)ナフチル、1,2,8-トリメチル-(3-、4-、5-、6-又は7-)ナフチル、1-ジメチルアミノ-(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-)ナフチル、2-ジメチルアミノ-(1-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-)ナフチル、3-メチルアミノ-(1-、2-、4-、5-、6-、7-又は8-)ナフチル、5-アミノ-(1-、2-、3-、4-、6-、7-又は8-)ナフチル、5-ジメチルアミノ-(1-、2-、3-、4-、6-、7-又は8-)ナフチル、4-(N-メチル-N-エチルアミノ)-(1-、2-、3-、5-、6-、7-又は8-)ナフチル、1-メチル-2-ジメチルアミノ-(3-、4-、5-、6-、7-又は8-)ナフチル、1-クロロ-(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-)ナフチル、1-アセチルアミノ-(2-、3-、4-、5-、6-、7-又は8-)ナフチル基等のナフタレン環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、ハロゲン原子並びに置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基なる群から選ばれた基を1～2個有することのあるアミノ基なる群から選ばれた基を1～3個有していてもよいナフチル基を例示できる。

10

20

【0182】

置換基として低級アルコキシ基を有することのあるアルキル基としては、前記置換基として低級アルコキシ基を有することのある低級アルキル基に加えて、ヘブチル、1-エチルペンチル、オクチル、7-メトキシヘブチル、1-エトキシヘブチル、2-プロポキシ-1-エチルペンチル、3-イソプロポキシオクチル、7-ブトキシヘブチル、8-ペンチルオキシオクチル、5-ヘキシルオキシ-1-エチルペンチル基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を有することのある炭素数1～8の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

30

【0183】

低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基としては、例えば、アミノメチル、2-アミノエチル、1-アミノエチル、3-アミノプロピル、4-アミノブチル、5-アミノペンチル、6-アミノヘキシル、1,1-ジメチル-2-アミノエチル、2-メチル-3-アミノプロピル、メチルアミノメチル、1-エチルアミノエチル、2-プロピルアミノエチル、3-イソプロピルアミノプロピル、4-ブチルアミノブチル、5-ペンチルアミノペンチル、6-ヘキシルアミノヘキシル、ジメチルアミノメチル、2-ジエチルアミノエチル、2-ジイソプロピルアミノエチル、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メチル、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エチル基等の炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有することのあるアミノ基が置換した炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

40

【0184】

シクロアルキル基としては、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘブチル、シクロオクチル、シクロノニル、シクロデシル、シクロウンデシル、シクロドデシル、シクロトリデシル、シクロテトラデシル、シクロペンタデシル、シクロヘキサデシル基等の炭素数3～16のシクロアルキル基を挙げることが

50

できる。

【0185】

シクロアルキル環上に低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよいシクロアルキル基としては、前記シクロアルキル基に加えて、4 - ジメチルアミノメチルシクロヘキシル、2 - (アミノメチル)シクロプロピル、3 - (2 - アミノメチル)シクロブチル、2 - (1 - アミノエチル)シクロペンチル、3 - (3 - アミノプロピル)シクロヘキシル、3 - (4 - アミノブチル)シクロヘプチル、4 - (5 - アミノペンチル)シクロオクチル、4 - (6 - アミノヘキシル)シクロヘキシル、2 - (1, 1 - ジメチル - 2 - アミノエチル)シクロヘプチル、3 - (2 - メチル - 3 - アミノプロピル)シクロペンチル、3 - (メチルアミノメチル)シクロヘキシル、2 - (1 - エチルアミノエチル)シクロオクチル、2 - (2 - プロピルアミノエチル)シクロヘキシル、3 - (3 - イソプロピルアミノプロピル)シクロペンチル、4 - (4 - ブチルアミノブチル)シクロヘプチル、2 - (5 - ペンチルアミノペンチル)シクロヘキシル、2 - (6 - ヘキシルアミノヘキシル)シクロペンチル、3 - (ジメチルアミノメチル)シクロヘキシル、3 - [(N - エチル - N - プロピルアミノ)メチル]シクロヘプチル、4 - [2 - (N - メチル - N - ヘキシルアミノ)エチル]シクロオクチル、4 - ジメチルアミノメチルシクロノニル、2 - (アミノメチル)シクロデシル、3 - (2 - アミノメチル)シクロウンデシル、2 - (1 - アミノエチル)シクロドデシル、3 - (3 - アミノプロピル)シクロトリデシル、3 - (4 - アミノブチル)シクロテトラデシル、4 - (5 - アミノペンチル)シクロペンタデシル、4 - (6 - アミノヘキシル)シクロヘキサデシル、2 - (1, 1 - ジメチル - 2 - アミノエチル)シクロノニル、3 - (2 - メチル - 3 - アミノプロピル)シクロデシル、3 - (メチルアミノメチル)シクロウンデシル、2 - (1 - エチルアミノエチル)シクロドデシル、2 - (2 - プロピルアミノエチル)シクロトリデシル、3 - (3 - イソプロピルアミノプロピル)シクロテトラデシル、4 - (4 - ブチルアミノブチル)シクロペンタデシル、2 - (5 - ペンチルアミノペンチル)シクロヘキサデシル、2 - (6 - ヘキシルアミノヘキシル)シクロノニル、3 - (ジメチルアミノメチル)シクロドデシル、3 - [(N - エチル - N - プロピルアミノ)メチル]シクロデシル、4 - [2 - (N - メチル - N - ヘキシルアミノ)エチル]シクロヘキサデシル、2, 2 - ジメチルシクロプロピル、2 - トリフルオロメチルシクロプロピル基等のシクロアルキル環上に炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1 ~ 2個有することのあるアミノ基が置換した炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を1 ~ 3個有することのある炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群から選ばれた基が1 ~ 3個置換していてもよい炭素数3 ~ 16のシクロアルキル基を例示できる。

10

20

30

【0186】

低級アルケニル基としては、例えば、ビニル、1 - プロペニル、1 - メチル - 1 - プロペニル、2 - メチル - 1 - プロペニル、2 - プロペニル、2 - ブテニル、1 - ブテニル、3 - ブテニル、2 - ペンテニル、1 - ペンテニル、3 - ペンテニル、4 - ペンテニル、1, 3 - ブタジエニル、1, 3 - ペンタジエニル、2 - ペンテン - 4 - イニル、2 - ヘキセニル、1 - ヘキセニル、5 - ヘキセニル、3 - ヘキセニル、4 - ヘキセニル、3, 3 - ジメチル - 1 - プロペニル、2 - エチル - 1 - プロペニル、1, 3, 5 - ヘキサトリエニル、1, 3 - ヘキサジエニル、1, 4 - ヘキサジエニル基等の二重結合を1 ~ 3個有する炭素数2 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基を例示できる。

40

置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルケニル基としては、前記低級アルケニル基に加えて、3, 3, 3 - トリフルオロ - 1 - プロペニル、2 - プロモビニル、3 - クロロ - 1 - プロペニル、3 - ヨード - 1 - メチル - 1 - プロペニル、3 - フルオロ - 2 - メチル - 1 - プロペニル、2 - ブテニル、4, 4, 3 - トリクロロ - 1 - ブテニル、4, 4 - ジフルオロ - 3 - ブテニル、5 - フルオロ - 2 - ペンテニル、5, 5, 3 - トリプロモ - 1 - ペンテニル、5 - クロロ - 3 - ペンテニル、5, 5, 5 - トリフルオロ - 4 - ペンテニル、4 - クロロ - 1, 3 - ブタジエニル、5 - フルオロ - 1, 3 - ペンタジ

50

エニル、5 - ブロモ - 2 - ペンテン - 4 - イニル、6 - フルオロ - 2 - ヘキセニル、6 , 6 , 5 - トリフルオロ - 1 - ヘキセニル、6 - クロロ - 5 - ヘキセニル、5 - ブロモ - 3 - ヘキセニル、6 - クロロ - 4 - ヘキセニル、3 , 3 - ジメチル - 2 - クロロ - 1 - プロペニル、3 - フルオロ - 2 - エチル - 1 - プロペニル、6 - クロロ - 1 , 3 , 5 - ヘキサトリエニル、6 - ブロモ - 1 , 3 - ヘキサジエニル、6 - フルオロ - 1 , 4 - ヘキサジエニル基等の置換基としてハロゲン原子を1 ~ 3個有することがあり、二重結合を1 ~ 3個有する炭素数2 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基を例示できる。

ベンゾイル基(フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及びハロゲン原子なる群から選ばれた基が1 ~ 3個有していてもよい)としては、例えば、ベンゾイル、3 , 4 - ジフルオロベンゾイル、2 - フルオロベンゾイル、3 - ブロモベンゾイル、4 - ヨードベンゾイル、4 - メチルベンゾイル、2 - メチルベンゾイル、3 - メチルベンゾイル、2 - エチルベンゾイル、3 - エチルベンゾイル、4 - エチルベンゾイル、4 - イソプロピルベンゾイル、3 - ブチルベンゾイル、4 - ペンチルベンゾイル、4 - ヘキシルベンゾイル、3 , 4 - ジメチルベンゾイル、3 , 4 - ジエチルベンゾイル、2 , 4 - ジメチルベンゾイル、2 , 5 - ジメチルベンゾイル、2 , 6 - ジメチルベンゾイル、3 , 4 , 5 - トリメチルベンゾイル、2 - トリフルオロメチルベンゾイル、3 - トリフルオロメチルベンゾイル、4 - トリフルオロメチルベンゾイル、2 - (ブロモメチル)ベンゾイル、3 - (2 - クロロエチル)ベンゾイル、4 - (2 , 3 - ジクロロプロピル)ベンゾイル、4 - (4 - フルオロブチル)ベンゾイル、3 - (5 - クロロペンチル)ベンゾイル、4 - (5 - ブロモヘキシル)ベンゾイル、4 - (5 , 6 - ジブロモヘキシル)ベンゾイル、3 , 4 - ジ(トリフルオロメチル)ベンゾイル、3 , 4 - ジ(4 , 4 , 4 - トリクロロブチル)ベンゾイル、2 , 4 - ジ(3 - クロロ - 2 - メチルプロピル)ベンゾイル、2 , 5 - ジ(3 - クロロプロピル)ベンゾイル、2 , 6 - ジ(2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル)ベンゾイル、3 , 4 , 5 - トリ(トリフルオロメチル)ベンゾイル、4 - (2 , 2 , 2 - トリクロロエチル)ベンゾイル、2 - メチル - 4 - トリフルオロメチルベンゾイル、3 - エチル - 4 - トリクロロメチルベンゾイル、2 - クロロ - 4 - トリフルオロメチルベンゾイル、3 - エチル - 4 - フルオロベンゾイル、3 - フルオロ - 4 - トリクロロメチルベンゾイル、2 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 4 - トリフルオロメチルベンゾイル、3 - フルオロベンゾイル、4 - フルオロベンゾイル、2 - ブロモベンゾイル、4 - ブロモベンゾイル、2 - ヨードベンゾイル、3 - ヨードベンゾイル、2 , 3 - ジブロモベンゾイル、2 , 4 - ジヨードベンゾイル、2 , 5 - ジフルオロベンゾイル、2 , 6 - ジクロロベンゾイル、2 , 4 , 6 - トリクロロベンゾイル、2 , 4 - ジフルオロベンゾイル、3 , 5 - ジフルオロベンゾイル、2 , 6 - ジフルオロベンゾイル、2 - クロロベンゾイル、3 - クロロベンゾイル、4 - クロロベンゾイル、2 , 3 - ジクロロベンゾイル、2 , 4 - ジクロロベンゾイル、2 , 5 - ジクロロベンゾイル、3 , 4 - ジクロロベンゾイル、2 , 6 - ジクロロベンゾイル、3 , 5 - ジクロロベンゾイル、2 , 4 , 6 - トリフルオロベンゾイル、2 , 4 - ジフルオロベンゾイル基等ベンゾイル基(フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子を1 ~ 3個有することのある炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基及びハロゲン原子なる群から選ばれた基が1 ~ 3個置換していてもよい)を例示できる。

ハロゲン置換低級アルキル基としては、例えば、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、フルオロメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、ジブロモメチル、2 - クロロエチル、2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル、2 , 2 , 2 - トリクロロエチル、3 - クロロプロピル、2 , 3 - ジクロロプロピル、4 , 4 , 4 - トリクロロブチル、4 - フルオロブチル、5 - クロロペンチル、3 - クロロ - 2 - メチルプロピル、5 - ブロモヘキシル、5 , 6 - ジブロモヘキシル基等の置換基としてハロゲン原子を1 ~ 3個有する炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0187】

低級アルキレンジオキシ基としては、例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリメチレンジオキシ、テトラメチレンジオキシ基等の炭素数1 ~ 4の直鎖又は分枝鎖状

10

20

30

40

50

のアルキレン基を例示できる。

【0188】

置換基として低級アルキル基、低級アルカノイル基、ベンゾイル基及びシクロアルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ、ジペンチルアミノ、ジヘキシルアミノ、N-メチル-N-エチルアミノ、N-エチル-N-プロピルアミノ、N-メチル-N-ブチルアミノ、N-メチル-N-ヘキシルアミノ、N-メチル-N-アセチルアミノ、N-アセチルアミノ、N-ホルミルアミノ、N-プロピオニルアミノ、N-ブチリルアミノ、N-イソブチリルアミノ、N-ペンタノイルアミノ、N-tert-ブチルカルボニルアミノ、N-ヘキサノイルアミノ、N-エチル-N-アセチルアミノ、N-ベンゾイルアミノ、N-エチル-N-ベンゾイルアミノ、N-メチル-N-ベンゾイルアミノ、N-アセチル-N-ベンゾイルアミノ、シクロプロピルアミノ、シクロブチルアミノ、シクロペンチルアミノ、シクロヘキシルアミノ、シクロヘブチルアミノ、シクロオクチルアミノ、N-メチル-N-シクロヘキシルアミノ、N-メチル-N-シクロペンチルアミノ、N-メチル-N-シクロヘブチルアミノ、N-シクロヘキシル-N-アセチルアミノ、N-シクロペンチル-N-ベンゾイルアミノ、シクロノニルアミノ、シクロデシルアミノ、シクロドデシルアミノ、シクロトリデシルアミノ、シクロテトラデシルアミノ、シクロペンタデシルアミノ、N-メチル-N-シクロヘキサデシルアミノ、N-メチル-N-シクロノニルアミノ、N-メチル-N-シクロデシルアミノ、N-シクロウンデシル-N-アセチルアミノ、N-シクロヘキサデシル-N-ベンゾイルアミノ基等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基、ベンゾイル基及び炭素数3~16のシクロアルキル基なる群から選ばれた基1~2個を有することのあるアミノ基を例示できる。

10

20

【0189】

置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルカノイル基としては、例えば前記低級アルカノイル基に加えて、2,2,2-トリフルオロアセチル、2,2,2-トリクロロアセチル、2-クロロアセチル、2-ブromoアセチル、2-フルオロアセチル、2-ヨードアセチル、2,2-ジフルオロアセチル、2,2-ジブromoアセチル、3,3,3-トリフルオロプロピオニル、3,3,3-トリクロロプロピオニル、3-クロロプロピオニル、2,3-ジクロロプロピオニル、4,4,4-トリクロロブチリル、4-フルオロブチリル、5-クロロペンタノイル、3-クロロ-2-メチルプロピオニル、6-ブromoヘキサノイル、5,6-ジブromoヘキサノイル基等の置換基としてハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を例示できる。

30

【0190】

低級アルコキシカルボニル基としては、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基を挙げることができる。

40

【0191】

低級アルカノイルオキシ基としては、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、イソブチリオキシ、ペンタノイルオキシ、tert-ブチルカルボニルオキシ、ヘキサノイルオキシ基等の炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基が挙げられる。

【0192】

窒素原子、酸素原子又は硫黄原子を1~4個有する5~6員の飽和又は不飽和複素環基としては、例えば、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリノ、チオモルホリノ、ピリジル、1,2,5,6-テトラヒドロピリジル、チエニル、ピラジル、ピリミジル、ピリダジル、ピロリル、2H-ピロリル、イミダゾリジニル、ピラゾリル、イミ

50

ダゾリル、ピラゾリジニル、フラザニル、2 - イミダゾリニル、イミダゾリジニル、2 - ピロリニル、フリル、オキサゾリル、イソオキサジリジニル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピラニル、2 - ピラゾリジニル、1, 2, 4 - トリアゾリル、1, 2, 3 - トリアゾリル、1, 2, 5 - トリアゾリル、チアゾリジニル、2 - チアゾリニル、1, 2, 3, 4 - テトラゾリル、1, 3, 4 - オキサジアゾリル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロフリル基等を例示できる。

【0193】

R¹¹とR¹²とが結合する窒素原子と共に、窒素原子、硫黄原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して形成する5～7員の飽和複素環としては、例えば、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリノ、チオモルホリノ、ホモピペラジニル基等を例示できる。

10

【0194】

イミダゾリル低級アルキル基としては、例えば、(1, 2, 4又は5-)イミダゾリルメチル、2 - [(1, 2, 4又は5-)イミダゾリル]エチル、1 - [(1, 2, 4又は5-)イミダゾリル]エチル、3 - [(1, 2, 4又は5-)イミダゾリル]プロピル、4 - [(1, 2, 4又は5-)イミダゾリル]ブチル、5 - [(1, 2, 4又は5-)イミダゾリル]ペンチル、6 - [(1, 2, 4又は5-)イミダゾリル]ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [(1, 2, 4又は5-)イミダゾリル]エチル、2 - メチル - 3 - [(1, 2, 4又は5-)イミダゾリル]プロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるイミダゾリルアルキル基を挙げることができる。

20

【0195】

1, 2, 4 - トリアゾリル低級アルキル基としては、例えば、(1, 3又は5-)1, 2, 4 - トリアゾリルメチル、2 - [(1, 3又は5-)1, 2, 4 - トリアゾリル]エチル、1 - [(1, 3又は5-)1, 2, 4 - トリアゾリル]エチル、3 - [(1, 3又は5-)1, 2, 4 - トリアゾリル]プロピル、4 - [(1, 3又は5-)1, 2, 4 - トリアゾリル]ブチル、5 - [(1, 3又は5-)1, 2, 4 - トリアゾリル]ペンチル、6 - [(1, 3又は5-)1, 2, 4 - トリアゾリル]ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [(1, 3又は5-)1, 2, 4 - トリアゾリル]エチル、2 - メチル - 3 - [(1, 3又は5-)1, 2, 4 - トリアゾリル]プロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である1, 2, 4 - トリアゾリルアルキル基を挙げることができる。

30

【0196】

1, 2, 3 - トリアゾリル低級アルキル基としては、例えば、(1, 4又は5-)1, 2, 3 - トリアゾリルメチル、2 - [(1, 4又は5-)1, 2, 3 - トリアゾリル]エチル、1 - [(1, 4又は5-)1, 2, 3 - トリアゾリル]エチル、3 - [(1, 4又は5-)1, 2, 3 - トリアゾリル]プロピル、4 - [(1, 4又は5-)1, 2, 3 - トリアゾリル]ブチル、5 - [(1, 4又は5-)1, 2, 3 - トリアゾリル]ペンチル、6 - [(1, 4又は5-)1, 2, 3 - トリアゾリル]ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [(1, 4又は5-)1, 2, 3 - トリアゾリル]エチル、2 - メチル - 3 - [(1, 4又は5-)1, 2, 3 - トリアゾリル]プロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である1, 2, 3 - トリアゾリルアルキル基を挙げることができる。

40

【0197】

1, 2, 5 - トリアゾリル低級アルキル基としては、例えば、(1, 3又は4-)1, 2, 5 - トリアゾリルメチル、2 - [(1, 3又は4-)1, 2, 5 - トリアゾリル]エチル、1 - [(1, 3又は4-)1, 2, 5 - トリアゾリル]エチル、3 - [(1, 3又は4-)1, 2, 5 - トリアゾリル]プロピル、4 - [(1, 3又は4-)1, 2, 5 - トリアゾリル]ブチル、5 - [(1, 3又は4-)1, 2, 5 - トリアゾリル]ペンチル、6 - [(1, 3又は4-)1, 2, 5 - トリアゾリル]ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [(1, 3又は4-)1, 2, 5 - トリアゾリル]エチル、2 - メチル - 3 - [(1

50

、3又は4 -) 1, 2, 5 - トリアゾリル] プロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である1, 2, 5 - トリアゾリルアルキル基を挙げることができる。

【0198】

ピラゾリル低級アルキル基としては、例えば、(1, 3, 4又は5 -)ピラゾリルメチル、2 - [(1, 3, 4又は5 -)ピラゾリル]エチル、1 - [(1, 3, 4又は5 -)ピラゾリル]エチル、3 - [(1, 3, 4又は5 -)ピラゾリル]プロピル、4 - [(1, 3, 4又は5 -)ピラゾリル]ブチル、5 - [(1, 3, 4又は5 -)ピラゾリル]ペンチル、6 - [(1, 3, 4又は5 -)ピラゾリル]ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [(1, 3, 4又は5 -)ピラゾリル]エチル、2 - メチル - 3 - [(1, 3, 4又は5 -)ピラゾリル]プロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピラゾリルアルキル基を挙げることができる。

10

【0199】

ピリミジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピリミジニル低級アルキル基としては、例えば、(2, 4, 5又は6 -)ピリミジニルメチル、2 - [(2, 4, 5又は6 -)ピリミジニル]エチル、1 - [(2, 4, 5又は6 -)ピリミジニル]エチル、3 - [(2, 4, 5又は6 -)ピリミジニル]プロピル、4 - [(2, 4, 5又は6 -)ピリミジニル]ブチル、5 - [(2, 4, 5又は6 -)ピリミジニル]ペンチル、6 - [(2, 4, 5又は6 -)ピリミジニル]ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [(2, 4, 5又は6 -)ピリミジニル]エチル、2 - メチル - 3 - [(2, 4, 5又は6 -)ピリミジニル]プロピル、[(1, 3, 4又は5 -)2, 6 - ジオキソピリミジニル]メチル、[(1, 3, 4, 5又は6 -)2 - オキソピリミジニル]メチル、[(1, 2, 4又は5 -)6 - オキソピリミジニル]メチル、[(1, 2, 5又は6 -)4 - オキソピリミジニル]メチル、[(1, 3, 5又は6 -)2, 4 - ジオキソピリミジニル]メチル、2 - [(4又は6 -)2, 5 - ジオキソピリミジニル]エチル、1 - [(1, 3, 4又は5 -)2, 6 - ジオキソピリミジニル]エチル、3 - [(1, 3又は5 -)2, 4, 6 - トリオキソピリミジニル]プロピル、4 - [(1, 3, 4又は5 -)2, 6 - ジオキソピリミジニル]ブチル、5 - [(4又は6 -)2, 5 - ジオキソピリミジニル]ペンチル、6 - [(1, 3, 5又は6 -)2, 4 - ジオキソピリミジニル]ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [(1, 3, 4又は5 -)2, 6 - ジオキソピリミジニル]エチル、2 - メチル - 3 - [(1, 3, 4又は5 -)2, 6 - ジオキソピリミジニル]プロピル基等のピリミジン環上に置換基としてオキソ基1~3個を有することがあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピリミジニルアルキル基を例示できる。

20

30

【0200】

3, 5 - ジオキソイソキサゾリジン - 4 - イリデン低級アルキル基としては、例えば、3, 5 - ジオキソイソキサゾリジン - 4 - イリデンメチル、3, 5 - ジオキソイソキサゾリジン - 4 - イリデンエチル、3, 5 - ジオキソイソキサゾリジン - 4 - イリデンプロピル、3, 5 - ジオキソイソキサゾリジン - 4 - イリデンイソプロピル、3, 5 - ジオキソイソキサゾリジン - 4 - イリデンブチル、3, 5 - ジオキソイソキサゾリジン - 4 - イリデンペンチル、3, 5 - ジオキソイソキサゾリジン - 4 - イリデンヘキシル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である3, 5 - ジオキソイソキサゾリジン - 4 - イリデンアルキル基を例示できる。

40

【0201】

1, 2, 4 - オキサジアゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのある1, 2, 4 - オキサジアゾリル低級アルキル基としては、例えば、(3又は5 -)1, 2, 4 - オキサジアゾリルメチル、2 - [(3又は5 -)1, 2, 4 - オキサジアゾリル]エチル、1 - [(3又は5 -)1, 2, 4 - オキサジアゾリル]エチル、3 - [(3又は5 -)1, 2, 4 - オキサジアゾリル]プロピル、4 - [(3又は5 -)1, 2, 4 - オキサジアゾリル]ブチル、5 - [(3又は5 -)1, 2, 4 - オキサジアゾリル]ペンチル、6 - [(3又は5 -)1, 2, 4 - オキサジアゾリル]ヘキシル、1, 1 - ジメチル

50

- 2 - [(3 又は 5 -) 1 , 2 , 4 - オキサジアゾリル] エチル、 2 - メチル - 3 - [(3 又は 5 -) 1 , 2 , 4 - オキサジアゾリル] プロピル、 5 - メチル - 3 - (1 , 2 , 4 - オキサジアゾリル) メチル、 3 - エチル - 2 - [5 - (1 , 2 , 4 - オキサジアゾリル)] エチル、 1 - [3 - プロピル - 5 - (1 , 2 , 4 - オキサジアゾリル)] エチル、 3 - [5 - ブチル - 3 - (1 , 2 , 4 - オキサジアゾリル)] プロピル、 4 - [3 - ペンチル - 5 - (1 , 2 , 4 - オキサジアゾリル)] ブチル、 5 - [5 - ヘキシル - 3 - (1 , 2 , 4 - オキサジアゾリル)] ペンチル、 6 - [3 - メチル - 5 - (1 , 2 , 4 - オキサジアゾリル)] ヘキシル、 1 , 1 - ジメチル - 2 - [5 - イソプロピル - 3 - (1 , 2 , 4 - オキサジアゾリル)] エチル、 2 - メチル - 3 - [3 - イソブチル - 5 - (1 , 2 , 4 - オキサジアゾリル)] プロピル基等の 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール環上に置換基として炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を有することがあり、アルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である 1 , 2 , 4 - オキサジアゾリルアルキル基を例示できる。

10

【 0 2 0 2 】

チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニル低級アルキル基としては、例えば、(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニルメチル、 2 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] エチル、 1 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] エチル、 3 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピル、 4 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] ブチル、 5 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] ペンチル、 6 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] ヘキシル、 1 , 1 - ジメチル - 2 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] エチル、 2 - メチル - 3 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピル、 2 , 4 - ジオキソ - 5 - チアゾリジニルメチル、 2 - [2 - オキソ - (3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] エチル、 1 - [4 - オキソ - (2 , 3 又は 5 -) チアゾリジニル] エチル、 3 - [5 - オキソ - (2 , 3 又は 4 -) チアゾリジニル] プロピル、 4 - [2 , 5 - ジオキソ - (3 又は 4 -) チアゾリジニル] ブチル、 5 - [2 , 4 , 5 - トリオキソ - 3 - チアゾリジニル] ペンチル、 6 - [4 , 5 - ジオキソ - (2 又は 3 -) チアゾリジニル] ヘキシル、 1 , 1 - ジメチル - 2 - [2 , 4 - ジオキソ - (3 又は 5 -) チアゾリジニル] エチル、 2 - メチル - 3 - [2 , 4 - ジオキソ - (3 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピル、 3 - [2 , 4 - ジオキソ - (3 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピル基等のチアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を 1 ~ 3 個有することがあり、アルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるチアゾリジニルアルキル基を例示できる。

20

30

【 0 2 0 3 】

フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基としては、例えば、前記フェニル低級アルキル基に加えて、 3 , 4 - メチレンジオキシベンジル、 3 , 4 - トリメチレンジオキシベンジル、 2 - (2 , 3 - エチレンジオキシフェニル) エチル、 1 - (3 , 4 - トリメチレンジオキシフェニル) エチル、 3 - (2 , 3 - テトラメチレンジオキシフェニル) プロピル、 4 - (3 , 4 - メチレンジオキシフェニル) ブチル、 5 - (2 , 3 - エチレンジオキシフェニル) ペンチル、 6 - (3 , 4 - トリメチレンジオキシフェニル) ヘキシル、 1 , 1 - ジメチル - 2 - (2 , 3 - メチレンジオキシフェニル) エチル、 2 - メチル - 3 - (3 , 4 - エチレンジオキシフェニル) プロピル基等のフェニル環上に置換基として炭素数 1 ~ 4 の直鎖又は分枝鎖状アルキレンジオキシ基を有することがあり、アルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基を例示できる。

40

【 0 2 0 4 】

低級アルコキシカルボニル低級アルキル基としては、例えば、メトキシカルボニルメチル、 エトキシカルボニルメチル、 2 - メトキシカルボニルエチル、 2 - エトキシカルボニルエチル、 1 - エトキシカルボニルエチル、 3 - メトキシカルボニルプロピル、 3 - エトキシカルボニルプロピル、 4 - エトキシカルボニルブチル、 5 - イソプロポキシカルボニルペンチル、 6 - プロポキシカルボニルヘキシル、 1 , 1 - ジメチル - 2 - ブトキシカル

50

ボニルエチル、2 - メチル - 3 - tert - ブトキシカルボニルプロピル、2 - ペンチルオキシカルボニルエチル、ヘキシルオキシカルボニルメチル基等のアルコキシ部分が炭素数が1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であり、アルキル部分が炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるアルコキシカルボニルアルキル基を例示できる。

【0205】

カルボキシ低級アルキル基としては、例えば、カルボキシメチル、2 - カルボキシエチル、1 - カルボキシエチル、3 - カルボキシプロピル、4 - カルボキシブチル、5 - カルボキシペンチル、6 - カルボキシヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - カルボキシエチル、2 - メチル - 3 - カルボキシプロピル基等のアルキル部分が炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるカルボキシアルキル基を例示できる。

10

【0206】

モルホリノ置換低級アルカノイル基としては、例えば、2 - [(2, 3又は4 -)モルホリノ]アセチル、3 - [(2, 3又は4 -)モルホリノ]プロピオニル、2 - [(2, 3又は4 -)モルホリノ]プロピオニル、4 - [(2, 3又は4 -)モルホリノ]ブチリル、5 - [(2, 3又は4 -)モルホリノ]ペンタノイル、6 - [(2, 3又は4 -)モルホリノ]ヘキサノイル、2, 2 - ジメチル - 2 - [(2, 3又は4 -)モルホリノ]プロピオニル、2 - メチル - 3 - [(2, 3又は4 -)モルホリノ]プロピオニル基等のアルカノイル部分が炭素数2 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるモルホリノ置換アルカノイル基を例示できる。

20

【0207】

フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基がピペラジン環上に置換していてもよいピペラジニルカルボニル低級アルキル基としては、例えば、[(1, 2又は3 -)ピペラジニル]カルボニルメチル、2 - [(1, 2又は3 -)ピペラジニル]カルボニルエチル、1 - [(1, 2又は3 -)ピペラジニル]カルボニルエチル、3 - [(1, 2又は3 -)ピペラジニル]カルボニルプロピル、4 - [(1, 2又は3 -)ピペラジニル]カルボニルブチル、5 - [(1, 2又は3 -)ピペラジニル]カルボニルペンチル、6 - [(1, 2又は3 -)ピペラジニル]カルボニルヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [(1, 2又は3 -)ピペラジニル]カルボニルエチル、2 - メチル - 3 - [(1, 2又は3 -)ピペラジニル]カルボニルプロピル、(4 - ベンジル - 1 - ピペラジニルカルボニル)メチル、2 - [4 - (2 - フェニルエチル) - 1 - ピペラジニルカルボニル]エチル、1 - [4 - (3 - フェニルプロピル) - 1 - ピペラジニルカルボニル]エチル、3 - [4 - (4 - フェニルブチル) - 1 - ピペラジニルカルボニル]プロピル、4 - [4 - (5 - フェニルペンチル) - 1 - ピペラジニルカルボニル]ブチル、5 - [4 - (6 - フェニルプロピル) - 1 - ピペラジニルカルボニル]ペンチル、6 - (4 - ベンジル - 1 - ピペラジニルカルボニル)ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - ベンジル - 1 - ピペラジニルカルボニル)エチル、2 - メチル - 3 - (4 - ベンジル - 1 - ピペラジニルカルボニル)プロピル、[4 - (3, 4 - メチレンジオキシベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニル]メチル、2 - {4 - [2 - (2, 3 - エチレンジオキシフェニル)エチル] - 1 - ピペラジニルカルボニル}エチル、1 - {4 - [3 - (3, 4 - トリメチレンジオキシフェニル)プロピル] - 1 - ピペラジニルカルボニル}エチル、3 - {4 - [4 - (2, 3 - テトラメチレンジオキシフェニル)ブチル] - 1 - ピペラジニルカルボニル}プロピル、4 - {4 - [5 - (3, 4 - メチレンジオキシフェニル)ペンチル] - 1 - ピペラジニルカルボニル}ブチル、5 - {4 - [3 - (2, 3 - エチレンジオキシフェニル)プロピル] - 1 - ピペラジニルカルボニル}ペンチル、6 - [4 - (3, 4 - トリメチレンジオキシベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニル]ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [4 - (2, 3 - テトラメチレンジオキシベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニル]エチル、2 - メチル - 3 - [4 - (3, 4 - メチレンジオキシベンジル) - 1 - ピペラジニルカルボニル]プロピル、(3, 4 - ジベンジル - 1 - ピペラジニルカルボニル)メチル、[2, 4 - ジ(3, 4 - メチレンジオキシベンジル) - 1 - ピペ

30

40

50

ラジニルカルボニル]メチル、[2, 4, 6-トリ(3, 4-メチレンジオキシベンジル)-1-ピペラジニルカルボニル]メチル、[3-ベンジル-4-(3, 4-メチレンジオキシベンジル)-1-ピペラジニルカルボニル]メチル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~4の直鎖又は分枝鎖状アルキリデンジオキシ基を有することのあるアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基がピペラジン環上に1~3個置換していてもよく且つアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピペラジニルカルボニルアルキル基を例示できる。

【0208】

フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基がピペラジン環上に置換していてもよいピペラジニル低級アルカノイル基としては、例えば、2-[(1, 2又は3-)ピペラジニル]アセチル、3-[(1, 2又は3-)ピペラジニル]プロピオニル、2-[(1, 2又は3-)ピペラジニル]プロピオニル、4-[(1, 2又は3-)ピペラジニル]ブチリル、5-[(1, 2又は3-)ピペラジニル]ペンタノイル、6-[(1, 2又は3-)ピペラジニル]ヘキサノイル、2, 2-ジメチル-3-[(1, 2又は3-)ピペラジニル]プロピオニル、2-メチル-3-[(1, 2又は3-)ピペラジニル]プロピオニル、2-(4-ベンジル-1-ピペラジニル)アセチル、3-[4-(2-フェニルエチル)-1-ピペラジニル]プロピオニル、2-[4-(3-フェニルプロピル)-1-ピペラジニル]プロピオニル、4-[4-(4-フェニルブチル)-1-ピペラジニル]ブチリル、5-[4-(5-フェニルペンチル)-1-ピペラジニル]ペンタノイル、6-[4-(6-フェニルプロピル)-1-ピペラジニル]ヘキサノイル、6-(4-ベンジル-1-ピペラジニル)ヘキサノイル、2, 2-ジメチル-3-(4-ベンジル-1-ピペラジニル)プロピオニル、2-メチル-3-(4-ベンジル-1-ピペラジニル)プロピオニル、2-[4-(3, 4-メチレンジオキシベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル、3-{4-[2-(2, 3-エチレンジオキシフェニル)エチル]-1-ピペラジニル}プロピオニル、2-{4-[3-(3, 4-トリメチレンジオキシフェニル)プロピル]-1-ピペラジニル}プロピオニル、4-{4-[4-(2, 3-テトラメチレンジオキシフェニル)ブチル]-1-ピペラジニル}ブチリル、5-{4-[5-(3, 4-メチレンジオキシフェニル)ペンチル]-1-ピペラジニル}ペンタノイル、5-{4-[3-(2, 3-エチレンジオキシフェニル)プロピル]-1-ピペラジニル}ペンタノイル、6-[4-(3, 4-トリメチレンジオキシベンジル)-1-ピペラジニル]ヘキサノイル、2, 2-ジメチル-3-[4-(2, 3-テトラメチレンジオキシベンジル)-1-ピペラジニル]プロピオニル、2-メチル-3-[4-(3, 4-メチレンジオキシベンジル)-1-ピペラジニル]プロピオニル、2-(3, 4-ジベンジル-1-ピペラジニル)アセチル、2-(3, 4, 5-トリベンジル-1-ピペラジニル)アセチル、2-[2, 4-ジ(3, 4-メチレンジオキシベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル、2-[2, 4, 6-トリ(3, 4-メチレンジオキシベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル、2-[3-ベンジル-4-(3, 4-メチレンジオキシベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~4の直鎖又は分枝鎖状アルキレンジオキシ基を有することのあるアルキル部分の炭素数が1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基がピペラジン環上に1~3個置換していてもよく且つアルカノイル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるピペラジニルアルカノイル基を例示できる。

【0209】

モルホリノカルボニル置換低級アルキル基としては、例えば、[(2, 3又は4-)モルホリノ]カルボニルメチル、2-[(2, 3又は4-)モルホリノ]カルボニルエチル、1-[(2, 3又は4-)モルホリノ]カルボニルエチル、3-[(2, 3又は4-)モルホリノ]カルボニルプロピル、4-[(2, 3又は4-)モルホリノ]カルボニルブチル、5-[(2, 3又は4-)モルホリノ]カルボニルペンチル、6-[(2, 3又は4-)モルホリノ]カルボニルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-[(2, 3又は4-)

10

20

30

40

50

モルホリノ]カルボニルエチル、2-メチル-3-[(2,3又は4-)モルホリノ]カルボニルプロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるモルホリノカルボニルアルキル基を例示できる。

【0210】

イミダゾリル低級アルカノイル基としては、例えば、2-[(1,2,4又は5-)イミダゾリル]アセチル、3-[(1,2,4又は5-)イミダゾリル]プロピオニル、2-[(1,2,4又は5-)イミダゾリル]プロピオニル、4-[(1,2,4又は5-)イミダゾリル]ブチリル、5-[(1,2,4又は5-)イミダゾリル]ペンタノイル、6-[(1,2,4又は5-)イミダゾリル]ヘキサノイル、2,2-ジメチル-3-[(1,2,4又は5-)イミダゾリル]プロピオニル、2-メチル-3-[(1,2,4又は5-)イミダゾリル]プロピオニル基等のアルカノイル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるイミダゾリルアルカノイル基を例示できる。

10

【0211】

シクロアルキルカルボニル基としては、例えばシクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル、シクロヘプチルカルボニル、シクロオクチルカルボニル、シクロノニルカルボニル、シクロデシルカルボニル、シクロウンデシルカルボニル、シクロドデシルカルボニル、シクロトリデシルカルボニル、シクロテトラデシルカルボニル、シクロペンタデシルカルボニル、シクロヘキサデシルカルボニル基等のシクロアルキル部分が炭素数3~16のシクロアルキル基であるシクロアルキルカルボニル基を挙げることができる。

20

【0212】

置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換低級アルカノイル基としては、例えば、アミノアセチル、2-アミノプロピオニル、3-アミノプロピオニル、4-アミノブチリル、5-アミノペンタノイル、6-アミノヘキサノイル、2,2-ジメチル-3-アミノプロピオニル、2-メチル-3-アミノプロピオニル、メチルアミノアセチル、2-エチルアミノプロピオニル、3-プロピルアミノプロピオニル、3-イソプロピルアミノプロピオニル、4-ブチルアミノブチリル、5-ペンチルアミノペンタノイル、6-ヘキシルアミノヘキサノイル、ジメチルアミノアセチル、3-ジイソプロピルアミノプロピオニル、(N-エチル-N-プロピルアミノ)アセチル、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)アセチル基等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基が置換した炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を例示できる。

30

【0213】

置換基として水酸基を有することのある低級アルキレン基としては、例えば、前記低級アルキレン基に加えて、1-ヒドロキシメチレン、2-ヒドロキシエチレン、1-ヒドロキシエチレン、2-ヒドロキシトリメチレン、3-ヒドロキシトリメチレン、1-ヒドロキシトリメチレン、3-ヒドロキシ-2-メチルトリメチレン、1-ヒドロキシ-2-メチルトリメチレン、3-ヒドロキシ-2,2-ジメチルトリメチレン、1-ヒドロキシ-2,2-ジメチルトリメチレン、3-ヒドロキシ-1-メチルトリメチレン、2-ヒドロキシ-1-メチルトリメチレン、1-ヒドロキシメチルメチレン、ヒドロキシメチルメチレン、2-ヒドロキシメチルトリメチレン、2-ヒドロキシメチル-2-メチルトリメチレン、(2-ヒドロキシエチル)メチレン、(1-ヒドロキシエチル)メチレン、4-ヒドロキシテトラメチレン、2-ヒドロキシテトラメチレン、3-ヒドロキシテトラメチレン、1-ヒドロキシテトラメチレン、5-ヒドロキシペンタメチレン、4-ヒドロキシペンタメチレン、3-ヒドロキシペンタメチレン、2-ヒドロキシペンタメチレン、1-ヒドロキシペンタメチレン、6-ヒドロキシヘキサメチレン、5-ヒドロキシヘキサメチレン、4-ヒドロキシヘキサメチレン、3-ヒドロキシヘキサメチレン、2-ヒドロキシヘキサメチレン、1-ヒドロキシヘキサメチレン、1,2-ジヒドロキシトリメチレン、2,2,4-トリヒドロキシテトラメチレン、1,2,6-トリヒドロキシヘキサメチレン、3,4,5-トリヒドロキシペンタメチレン基等の置換基として水酸基を1~3個有する

40

50

ことのある炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状のアルキレン基を例示できる。

【 0 2 1 4 】

置換基として水酸基を有することのあるアルキル基としては、例えば、前記低級アルキル基に加えて、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウンデシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル、1 - メチルヘキシル、ヘキサデシル、ヒドロキシメチル、2 - ヒドロキシエチル、1 - ヒドロキシエチル、3 - ヒドロキシプロピル、2 , 3 - ジヒドロキシプロピル、4 - ヒドロキシブチル、1 , 1 - ジメチル - 2 - ヒドロキシエチル、5 , 5 , 4 - トリヒドロキシペンチル、5 - ヒドロキシペンチル、6 - ヒドロキシヘキシル、1 - ヒドロキシイソプロピル、2 - メチル - 3 - ヒドロキシプロピル基等の置換基として水酸基を 1 ~ 3 個有することのある炭素数 1 ~ 16 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

10

【 0 2 1 5 】

水酸基置換アルキル基としては、例えば、ヒドロキシメチル、2 - ヒドロキシエチル、1 - ヒドロキシエチル、3 - ヒドロキシプロピル、2 , 3 - ジヒドロキシプロピル、4 - ヒドロキシブチル、1 , 1 - ジメチル - 2 - ヒドロキシエチル、5 , 5 , 4 - トリヒドロキシペンチル、5 - ヒドロキシペンチル、6 - ヒドロキシヘキシル、1 - ヒドロキシイソプロピル、2 - メチル - 3 - ヒドロキシプロピル基等の置換基として水酸基を 1 ~ 3 個有する炭素数 1 ~ 16 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【 0 2 1 6 】

置換基として水酸基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるシクロアルキル基としては、例えば、前記シクロアルキル基に加えて、2 - ヒドロキシシクロプロピル、3 - ヒドロキシシクロブチル、3 - ヒドロキシシクロペンチル、2 - ヒドロキシシクロヘキシル、4 - ヒドロキシシクロヘキシル、3 - ヒドロキシシクロヘプチル、4 - ヒドロキシシクロオクチル、5 - ヒドロキシシクロノニル、3 - ヒドロキシシクロデシル、4 - ヒドロキシシクロウンデシル、5 - ヒドロキシシクロドデシル、6 - ヒドロキシシクロトリデシル、7 - ヒドロキシシクロテトラデシル、6 - ヒドロキシシクロペンタデシル、8 - ヒドロキシシクロヘキサデシル、2 , 4 - ジヒドロキシシクロヘキシル、2 , 4 , 6 - トリヒドロキシシクロヘキシル、1 - メチルシクロペンチル、2 - エチルシクロプロピル、3 - n - プロピルシクロブチル、2 - n - ブチルシクロヘキシル、4 - n - ペンチルシクロヘプチル、4 - n - ヘキシルシクロオクチル、2 , 3 - ジメチルシクロヘキシル、2 , 3 , 4 - トリメチルシクロヘキシル、2 - メチル - 4 - ヒドロキシシクロヘキシル基等の置換基として水酸基及び炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群から選ばれる基を 1 ~ 3 個有することのある炭素数 3 ~ 16 のシクロアルキル基を挙げる事ができる。

20

30

【 0 2 1 7 】

フェノキシ低級アルキル基としては、例えば、フェノキシメチル、2 - フェノキシエチル、1 - フェノキシエチル、3 - フェノキシプロピル、4 - フェノキシブチル、1 , 1 - ジメチル - 2 - フェノキシエチル、5 - フェノキシペンチル、6 - フェノキシヘキシル、1 - フェノキシイソプロピル、2 - メチル - 3 - フェノキシプロピル基等のアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェノキシアルキル基を例示できる。

40

【 0 2 1 8 】

置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基としては、例えば、アミノメトキシ、2 - アミノエトキシ、1 - アミノエトキシ、3 - アミノプロポキシ、4 - アミノブトキシ、5 - アミノペンチルオキシ、6 - アミノヘキシルオキシ、1 , 1 - ジメチル - 2 - アミノエトキシ、2 - メチル - 3 - アミノプロポキシ、メチルアミノメトキシ、1 - エチルアミノエトキシ、2 - プロピルアミノエトキシ、3 - イソプロピルアミノプロポキシ、4 - ブチルアミノブトキシ、5 - ペンチルアミノペンチルオキシ、6 - ヘキシルアミノヘキシルオキシ、ジメチルアミノメトキシ、2 - ジエチルアミノエトキシ、2 - ジイソプロピルアミノエトキシ、(N - エチル - N - プロピルアミノ) メトキシ

50

、2 - (N - メチル - N - ヘキシルアミノ) エトキシ基等の炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1 ~ 2 個有することのあるアミノ基が置換した炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【 0 2 1 9 】

水酸基置換低級アルキル基としては、例えば、ヒドロキシメチル、1 - ヒドロキシエチル、2 - ヒドロキシエチル、3 - ヒドロキシプロピル、2 , 3 - ジヒドロキシプロピル、4 - ヒドロキシブチル、1 , 1 - ジメチル - 2 - ヒドロキシエチル、5 , 5 , 4 - トリヒドロキシペンチル、5 - ヒドロキシペンチル、6 - ヒドロキシヘキシル、1 - ヒドロキシイソプロピル、2 - メチル - 3 - ヒドロキシプロピル基等の置換基として水酸基を 1 ~ 3 個有する炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

10

【 0 2 2 0 】

置換基として低級アルキルスルホニルを有することのあるアミノ基としては、アミノ、メチルスルホニルアミノ、エチルスルホニルアミノ、プロピルスルホニルアミノ、イソプロピルスルホニルアミノ、ブチルスルホニルアミノ、tert - ブチルスルホニルアミノ、ペンチルスルホニルアミノ、ヘキシルスルホニルアミノ、ジメチルスルホニルアミノ、ジエチルスルホニルアミノ、ジプロピルスルホニルアミノ、ジブチルスルホニルアミノ、ジペンチルスルホニルアミノ、ジヘキシルスルホニルアミノ、N - メチルスルホニル - N - エチルスルホニルアミノ、N - エチルスルホニル - N - プロピルスルホニルアミノ、N - メチルスルホニル - N - ブチルスルホニルアミノ、N - メチルスルホニル - N - ヘキシルスルホニルアミノ基等の置換基として炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基を 1 ~ 2 個有することのあるアミノ基を例示できる。

20

【 0 2 2 1 】

低級アルキニル基としては、例えば、エチニル、2 - プロピニル、2 - ブチニル、3 - ブチニル、1 - メチル - 2 - プロピニル、2 - ペンチニル、2 - ヘキシニル基等の炭素数 2 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキニル基を例示できる。

【 0 2 2 2 】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるアニリノ基としては、例えば、アニリノ、2 - フルオロアニリノ、3 - フルオロアニリノ、4 - フルオロアニリノ、2 - プロモアニリノ、3 - プロモアニリノ、4 - プロモアニリノ、2 - ヨードアニリノ、3 - ヨードアニリノ、4 - ヨードアニリノ、2 , 3 - ジプロモアニリノ、2 , 4 - ジヨードアニリノ、2 , 5 - ジフルオロアニリノ、2 , 6 - ジクロロアニリノ、2 , 4 , 6 - トリクロロアニリノ、2 , 6 - ジフルオロアニリノ、3 , 5 - ジフルオロアニリノ、2 , 6 - ジフルオロアニリノ、2 - クロロアニリノ、3 - クロロアニリノ、4 - クロロアニリノ、2 , 3 - ジクロロアニリノ、2 , 4 - ジクロロアニリノ、2 , 5 - ジクロロアニリノ、3 , 4 - ジクロロアニリノ、2 , 6 - ジクロロアニリノ、3 , 5 - ジクロロアニリノ、2 , 4 , 6 - トリフルオロアニリノ、2 , 4 - ジフルオロアニリノ、3 , 4 - ジフルオロアニリノ基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を 1 ~ 3 個有することのあるアニリノ基を例示できる。

30

【 0 2 2 3 】

ピペラジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペラジニル基としては、例えば、(1 - 、2 - 又は 3 -) ピペラジニル、4 - メチル - (1 - 、2 - 、又は 3 -) ピペラジニル、2 , 3 - ジメチル - (1 - 又は 5 -) ピペラジニル、2 , 3 , 4 - トリメチル - (1 - 、5 - 又は 6 -) ピペラジニル基等のピペラジン環上に置換基として炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1 ~ 3 個有することのあるピペラジニル基を例示できる。

40

【 0 2 2 4 】

ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニル基としては、例えば、(1 - 、2 - 又は 3 -) ピロリジニル、2 - オキソ - (1 - 、3 - 、4 - 又は 5 -) ピロリジニル、3 - オキソ - (1 - 、2 - 、4 - 又は 5 -) ピロリジニル、2 , 3 - ジオキソ - (1 - 、4 - 又は 5 -) ピロリジニル、2 , 5 - ジオキソ - (1 - 、3 - 又は

50

4 -) ピロリジニル基等のピロリジン環上に置換基としてオキソ基を1～2個有することのあるピロリジニル基を例示できる。

低級アルカノイルアミノ基としては、例えば、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ、ペンタノイルアミノ、2-メチルプロピオニルアミノ、ヘキサノイルアミノ基等の置換基としてハロゲン原子を1～3個有する炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルアミノ基を例示できる。

【0225】

フェニル環上に低級アルキル基；置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基；ハロゲン原子；置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ低級アルコキシ基；水酸基置換低級アルキル基；フェニル低級アルキル基；低級アルキニル基；置換基として低級アルキルスルホニル基を有することのあるアミノ基；低級アルキルチオ基；シクロアルキル基；フェニルチオ基；アダマンチル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるアニリノ基；低級アルコキシカルボニル基；ピペラジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペラジニル基；低級アルカノイルアミノ基；シアノ基；ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピロリジニル基；及びフェノキシ基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよいフェニル基としては、例えば、フェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2-エチルフェニル、3-エチルフェニル、4-エチルフェニル、2-イソプロピルフェニル、4-イソプロピルフェニル、3-ブチルフェニル、4-ペンチルフェニル、4-ヘキシルフェニル、3,4-ジメチルフェニル、3,4-ジエチルフェニル、2,4-ジメチルフェニル、2,5-ジメチルフェニル、2,6-ジメチルフェニル、3,4,5-トリメチルフェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2-エトキシフェニル、3-エトキシフェニル、4-エトキシフェニル、4-イソプロポキシフェニル、3-ブトキシフェニル、4-ペンチルオキシフェニル、4-ヘキシルオキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,4-ジエトキシフェニル、2,4-ジメトキシフェニル、2,5-ジメトキシフェニル、2,6-ジメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、2-トリフルオロメトキシフェニル、3-トリフルオロメトキシフェニル、4-トリフルオロメトキシフェニル、2-(プロモメトキシ)フェニル、3-(2-クロロエトキシ)フェニル、4-(2,3-ジクロロプロポキシ)フェニル、4-(4-フルオロブトキシ)フェニル、3-(5-クロロペンチルオキシ)フェニル、4-(5-プロモヘキシルオキシ)フェニル、4-(5,6-ジプロモヘキシルオキシ)フェニル、3,4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェニル、3,4-ジ(4,4,4-トリクロロブトキシ)フェニル、2,4-ジ(3-クロロ-2-メトキシプロピル)フェニル、2,5-ジ(3-クロロプロポキシ)フェニル、2,6-ジ(2,2,2-トリフルオロエトキシ)フェニル、3,4,5-トリ(トリフルオロメトキシ)フェニル、4-(2,2,2-トリクロロエトキシ)フェニル、2-メチル-4-トリフルオロメトキシフェニル、3-エチル-4-トリクロロメトキシフェニル、2-メトキシ-4-トリフルオロメトキシフェニル、3-エトキシ-4-トリクロロメトキシフェニル、2-メチル-3-トリフルオロメトキシ-4-トリフルオロメトキシフェニル、2-フェノキシフェニル、3-フェノキシフェニル、4-フェノキシフェニル、2,3-ジフェノキシフェニル、3,4-ジフェノキシフェニル、2,6-ジフェノキシフェニル、3,4,5-トリフェノキシフェニル、2-メチル-4-フェノキシフェニル、3-エチル-4-フェノキシフェニル、2-メトキシ-4-フェノキシフェニル、3-エトキシ-4-フェノキシフェニル、2-メチル-3-フェノキシ-4-トリフルオロメトキシフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2,3-ジクロロフェニル、2,4-ジクロロフェニル、2,5-ジクロロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、2,6-ジクロロフェニル、3,5-ジクロロフェニル、2,4,6-トリクロロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2,5-ジフルオロフェニル、2,4-ジフルオロフェニル、3,4-ジフルオロフェニル、3,5-ジフルオロフェニル、2,6-ジフルオロフェニル、2,4,6-トリフル

オロフェニル、2 - ブロモフェニル、3 - ブロモフェニル、4 - ブロモフェニル、2 - ヨードフェニル、3 - ヨードフェニル、4 - ヨードフェニル、2, 3 - ジブロモフェニル、2, 4 - ジヨードフェニル、4 - メチルチオフェニル、4 - シクロヘキシルフェニル、4 - クロロ - 2 - アニリノフェニル、2 - (4 - クロロアニリノ) - 5 - エトキシカルボニルフェニル、4 - [2 - (N, N - ジエチルアミノ) エトキシ] フェニル、4 - (4 - メチル - 1 - ピペラジニル) フェニル、4 - (2 - オキソ - 1 - ピロリジニル) フェニル、4 - メチルスルホニルアミノフェニル、4 - (2 - ヒドロキシエチル) フェニル、4 - ベンジルフェニル、4 - エチニルフェニル、4 - フェニルチオフェニル、4 - (1 - アダマンチル) フェニル、5 - アセチルアミノ - 2 - クロロフェニル、2 - プロパノイルアミノフェニル、3 - シアノフェニル、2 - シアノフェニル、4 - シアノフェニル、3, 4 - ジシアノフェニル、3, 4, 5 - トリシアノフェニル基等のフェニル環上に炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、ハロゲン原子を 1 ~ 3 個有することのある炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、ハロゲン原子、アルコキシ部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であり、置換基として炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1 ~ 2 個有することのあるアミノアルコキシ基、置換基として水酸基を 1 ~ 3 個有する炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、アルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基、炭素数 2 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキニル基、置換基として炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基を 1 ~ 2 個有することのあるアミノ基、炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキルチオ基、炭素数 3 ~ 16 のシクロアルキル基、フェニルチオ基、アダマンチル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を 1 ~ 3 個有することのあるアニリノ基、炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基、炭素数 2 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を 1 ~ 2 個有するアミノ基、シアノ基、ピペラジン環上に置換基として炭素数が 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1 ~ 3 個有することのあるピペラジニル基、ピロリジン環上に置換基としてオキソ基を 1 ~ 2 個有することのあるピロリジニル基及びフェノキシ基なる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよいフェニル基を例示できる。

10

20

30

40

50

【0226】

フェニル環上にハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよいフェニル低級アルキル基としては、例えば、前記フェニル低級アルキル基に加えて、4 - フルオロベンジル、2 - クロロベンジル、3 - クロロベンジル、4 - クロロベンジル、2 - (2 - フルオロフェニル) エチル、2 - (4 - フルオロフェニル) エチル、2 - (4 - クロロフェニル) エチル、3, 4 - ジブロモベンジル、3, 4 - ジヨードベンジル、2, 4 - ジフルオロベンジル、2, 5 - ジクロロベンジル、2, 6 - ジクロロベンジル、3, 4, 5 - トリフルオロベンジル、3 - (4 - クロロフェニル) プロピル、1 - (2 - ブロモフェニル) エチル、4 - (3 - フルオロフェニル) ブチル、5 - (4 - ヨードフェニル) ペンチル、6 - (4 - クロロフェニル) ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - (3 - フルオロフェニル) エチル、2 - メチル - 3 - (4 - クロロフェニル) プロピル、2 - メチルベンジル、2 - (3 - メチルフェニル) エチル、3 - (4 - メチルフェニル) プロピル、1 - (2 - エチルフェニル) エチル、4 - (3 - エチルフェニル) ブチル、5 - (4 - エチルフェニル) ペンチル、6 - (4 - イソプロピルフェニル) ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - (3 - ブチルフェニル) エチル、2 - メチル - 3 - (4 - ペンチルフェニル) プロピル、4 - ヘキシルベンジル、3, 4 - ジメチルベンジル、3, 4 - ジエチルベンジル、2, 4 - ジメチルベンジル、2, 5 - ジメチルベンジル、2, 6 - ジメチルベンジル、3, 4, 5 - トリメチルベンジル、2 - メトキシベンジル、2 - (2 - メトキシフェニル) エチル、2 - (3 - メトキシフェニル) エチル、2 - (4 - メトキシフェニル) エチル、4 - メトキシベンジル、1 - (2 - エトキシフェニル) エチル、3 - (3 - エトキシフェニル) プロピル、4 - (4 - エトキシフェニル) ブチル、5 - (4 - イソプロポキシフェニル) ペンチル、6 - (3 - ブトキシフェニル) ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - ペンチルオキシフェニル) エチル、2 - メチル - 3 - (4 - ヘキシルオキシフェニル) プロ

ピル、3, 4 - ジメトキシベンジル、3, 4 - ジエトキシベンジル、2, 4 - ジメトキシ
 ベンジル、2, 5 - ジメトキシベンジル、2, 6 - ジメトキシベンジル、3, 4, 5 - ト
 リメトキシベンジル、2 - トリフルオロメトキシベンジル、3 - トリフルオロメトキシベ
 ンジル、4 - トリフルオロメトキシベンジル、2 - [2 - (プロモメトキシ)フェニル]
 エチル、1 - [3 - (2 - クロロエトキシ)フェニル]エチル、3 - [4 - (2, 3 - ジ
 クロロプロポキシ)フェニル]プロピル、4 - [4 - (4 - フルオロプロトキシ)フェニル
]ブチル、5 - [3 - (5 - クロロペンチルオキシ)フェニル]ペンチル、6 - [4 - (5
 - プロモヘキシルオキシ)フェニル]ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [4 - (5,
 6 - ジプロモヘキシルオキシ)フェニル]エチル、3, 4 - ジ(トリフルオロメトキシ)
 ベンジル、3, 4 - ジ(4, 4, 4 - トリクロロプロトキシ)ベンジル、2, 4 - ジ(3 -
 クロロ - 2 - メトキシプロピル)ベンジル、2, 5 - ジ(3 - クロロプロポキシ)ベンジ
 ル、2, 6 - ジ(2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ベンジル、3, 4, 5 - トリ(トリ
 フルオロメトキシ)ベンジル、4 - (2, 2, 2 - トリクロロエトキシ)ベンジル、2
 - メチル - 4 - トリフルオロメトキシベンジル、3 - エチル - 4 - トリクロロメトキシベ
 ンジル、2 - メトキシ - 4 - トリフルオロメトキシベンジル、3 - エトキシ - 4 - トリク
 ロロメトキシベンジル、2 - メチル - 3 - トリフルオロメトキシ - 4 - トリフルオロメ
 トキシベンジル、2 - クロロ - 3 - メチルベンジル、4 - フルオロ - 2 - トリフルオロメ
 トキシベンジル、3 - クロロ - 2 - メチル - 4 - メトキシベンジル基等のフェニル環上にハ
 ロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を1 ~ 3個有することのある炭素数1 ~ 6の直鎖
 又は分枝鎖状アルコキシ基及び炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群から選
 ばれた基が1 ~ 3個置換していてもよく且つアルキル部分が炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝
 鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基を例示できる。

10

20

30

40

50

【0227】

フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有するフェニル低級アルキル
 基としては、例えば、3, 4 - メチレンジオキシベンジル、3, 4 - トリメチレンジオキ
 シベンジル、2 - (2, 3 - エチレンジオキシフェニル)エチル、1 - (3, 4 - トリメ
 チレンジオキシフェニル)エチル、3 - (2, 3 - テトラメチレンジオキシフェニル)プ
 ロピル、4 - (3, 4 - メチレンジオキシフェニル)ブチル、5 - (2, 3 - エチレンジ
 オキシフェニル)ペンチル、6 - (3, 4 - トリメチレンジオキシフェニル)ヘキシル、
 1, 1 - ジメチル - 2 - (2, 3 - メチレンジオキシフェニル)エチル、2 - メチル - 3
 - (3, 4 - エチレンジオキシフェニル)プロピル基等のフェニル環上に置換基として炭
 素数1 ~ 4の直鎖又は分枝鎖状アルキレンジオキシ基を有し、アルキル部分が炭素数1 ~
 6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基を例示できる。

【0228】

置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミ
 ノ、N - アセチルアミノ、N - ホルミルアミノ、N - プロピオニルアミノ、N - ブチリル
 アミノ、N - イソブチリルアミノ、N - ペンタノイルアミノ、N - tert - ブチルカル
 ボニルアミノ、N - ヘキサノイルアミノ基等の置換基として炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝
 鎖状アルカノイル基を有することのあるアミノ基を例示できる。

【0229】

テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキソ基、低級アルコキシ基、及び低級アル
 キレンジオキシ基なる群から選ばれた基を1 ~ 3個有することのある1, 2, 3, 4 - テ
 トラヒドロキノリル基としては、例えば、(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7又は8 -)1,
 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル、2 - オキソ - (1, 3, 4, 5, 6, 7又は8 -)
 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル、2 - オキソ - 6, 7 - メチレンジオキシ - (1
 , 3, 4, 5又は8 -)1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル、4 - オキソ - (1, 2
 , 3, 5, 6, 7又は8 -)1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル、2, 4 - ジオキソ
 - (1, 3, 5, 6, 7又は8 -)1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル、2, 4 - ジ
 オキソ - 6, 7 - メチレンジオキシ - (1, 3, 5又は8 -)1, 2, 3, 4 - テトラヒ
 ドロキノリル、5, 6 - エチレンジオキシ - (1, 2, 3, 4, 7又は8 -)1, 2, 3

、4-テトラヒドロキノリル、7、8-トリメチレンジオキシ-(1,2,3,4,5又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロキノリル、6,7-テトラメチレンジオキシ-(1,2,3,4,5又は8-)1,2,3,4-テトラヒドロキノリル、5-メトキシ-2-オキソ-(1,3,4,6,7又は8-)1,2,3,4-テトラヒドロキノリル、2-オキソ-6,7-エチレンジオキシ-(1,3,4,5又は8-)1,2,3,4-テトラヒドロキノリル基等のテトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキソ基、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基及び炭素数1~4の直鎖又は分枝鎖状アルキレンジオキシ基なる群から選ばれた基を1~3個有することのある1,2,3,4-テトラヒドロキノリル基を例示できる。

【0230】

シクロアルキル低級アルキル基としては、例えば、シクロプロピルメチル、シクロヘキシルメチル、2-シクロプロピルエチル、1-シクロブチルエチル、3-シクロペンチルプロピル、4-シクロヘキシルブチル、5-シクロヘプチルペンチル、6-シクロオクチルヘキシル、1,1-ジメチル-2-シクロノニルエチル、2-メチル-3-シクロデシルプロピル、シクロウンデシルメチル、2-シクロドデシルエチル、1-シクロトリデシルエチル、3-シクロテトラデシルプロピル、4-シクロペンタデシルブチル、5-シクロヘキサデシルペンチル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である炭素数3~16のシクロアルキルアルキル基を挙げることができる。

【0231】

ピリジル低級アルキル基としては、例えば、(2,3又は4-)ピリジルメチル、2-[(2,3又は4-)ピリジル]エチル、1-[(2,3又は4-)ピリジル]エチル、3-[(2,3又は4-)ピリジル]プロピル、4-[(2,3又は4-)ピリジル]ブチル、1,1-ジメチル-2-[(2,3又は4-)ピリジル]エチル、5-[(2,3又は4-)ピリジル]ペンチル、6-[(2,3又は4-)ピリジル]ヘキシル、1-[(2,3又は4-)ピリジル]イソプロピル、2-メチル-3-[(2,3又は4-)ピリジル]プロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピリジルアルキル基を例示できる。

【0232】

置換基として低級アルキル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基置換低級アルキル基としては、例えば、アミノメチル、2-アミノエチル、1-アミノエチル、3-アミノプロピル、4-アミノブチル、5-アミノペンチル、6-アミノヘキシル、1,1-ジメチル-2-アミノエチル、2-メチル-3-アミノプロピル、メチルアミノメチル、1-エチルアミノエチル、2-プロピルアミノエチル、3-イソプロピルアミノプロピル、4-ブチルアミノブチル、5-ペンチルアミノペンチル、6-ヘキシルアミノヘキシル、ジメチルアミノメチル、2-ジイソプロピルアミノエチル、(N-エチル-N-プロピルアミノ)メチル、2-(N,N-ジメチルアミノ)エチル、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)エチル、ホルミルアミノメチル、アセチルアミノメチル、1-プロピオニルアミノエチル、2-アセチルアミノエチル、3-ブチリルアミノプロピル、4-ペンタノイルアミノブチル、5-ヘキサノイルアミノペンチル、6-アセチルアミノヘキシル、N-メチル-N-アセチルアミノメチル、2-(N-エチル-N-プロパノイルアミノ)エチル、(N-エチル-N-ブチリルアミノ)メチル、2-(N-メチル-N-ヘキサノイルアミノ)エチル、3-(N,N-ジメチルアミノ)プロピル基等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基なる群より選ばれた基を1~2個有することのあるアミノ基を有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0233】

低級アルコキシ低級アルキル基としては、例えば、メトキシメチル、1-エトキシエチル、2-メトキシエチル、2-プロポキシエチル、3-イソプロポキシプロピル、4-ブトキシブチル、5-ペンチルオキシペンチル、6-ヘキシルオキシヘキシル、1,1-ジメチル-2-メトキシエチル、2-メチル-3-エトキシプロピル、3-メトキシプロピ

10

20

30

40

50

ル基等の置換基として炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を有する炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【 0 2 3 4 】

1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリルカルボニル置換低級アルキル基としては、例えば、(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 又は 8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリルカルボニルメチル、2 - [(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 又は 8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリルカルボニル] エチル、1 - [((1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 又は 8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリルカルボニル] エチル、3 - [(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 又は 8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリルカルボニル] プロピル、4 - [(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 又は 8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリルカルボニル] ブチル、1, 1 - ジメチル - 2 - [(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 又は 8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリルカルボニル] エチル、5 - [(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 又は 8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリルカルボニル] ペンチル、6 - [(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 又は 8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリルカルボニル] ヘキシル、1 - [(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 又は 8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリルカルボニル] イソプロピル、2 - メチル - 3 - [(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 又は 8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリルカルボニル] プロピル基等のアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリルカルボニルアルキル基を例示できる。

10

20

【 0 2 3 5 】

ピペリジン環上に置換基として低級アルコシカルボニル基、フェニル低級アルキル基及びフリル低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピペリジニルカルボニル基としては、例えば、(1, 2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - ベンジル - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - (2 又は 3 -) フリルメチル - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - (2 - フェニルエチル) - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - { 2 - [(1 又は 2 -) フリル] エチル } - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - (1 - フェニルエチル) - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - { 3 - [(1 又は 2 -) フリル] プロピル } - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - (3 - フェニルプロピル) - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - { 1 - [(1 又は 2 -) フリル] エチル } - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - (4 - フェニルブチル) - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - { 4 - [(1 又は 2 -) フリル] ブチル } - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - (5 - フェニルペンチル) - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - { 5 - [(1 又は 2 -) フリル] ペンチル } - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - (6 - フェニルヘキシル) - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - { 6 - [(1 又は 2 -) フリル] ヘキシル } - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1, 2 - ジベンジル - (3, 4, 5 又は 6 -) ピペリジニルカルボニル、1, 3 - ジ (1 又は 2 -) フリルメチル - (2, 4, 5 又は 6 -) ピペリジニルカルボニル、1, 3, 5 - トリベンジル - (2, 4 又は 6 -) ピペリジニルカルボニル、1, 2, 6 - トリ (1 又は 2 -) フリルメチル - (3, 4 又は 5 -) ピペリジニルカルボニル、1 - ベンジル - 3 - (1 又は 2 -) フリルメチル - (2, 4, 5 又は 6 -) ピペリジニルカルボニル、1 - { 1 - [(1 又は 2 -) フリル] エチル } - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - メトキシカルボニル - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - エトキシカルボニル - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - プロポキシカルボニル - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - ブトキシカルボニル - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - tert - ブトキシカルボニル - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - ペンチルオキシカルボニル - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1 - ヘキシルオキシカルボニル - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニルカルボニル、1, 2 - ジメトキシカルボニル - (

30

40

50

3, 4, 5 又は 6 -) ピペリジニルカルボニル、1, 2, 6 - トリエトキシカルボニル - (3, 4 又は 5 -) ピペリジニルカルボニル、1 - (1 又は 2 -) フリルメチル - 3 - tert - ブトキシカルボニル - (3, 4, 5 又は 6 -) ピペリジニルカルボニル、1 - ベンジル - 2 - メトキシカルボニル - (2, 4, 5 又は 6 -) ピペリジニルカルボニル、1 - (1 又は 2 -) フリルメチル - 2, 4 - ジメトキシカルボニル - (3, 5 又は 6 -) ピペリジニルカルボニル基等のピペリジン環上に置換基としてアルコキシ部分の炭素数が 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基、アルキル部分の炭素数が 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基及びアルキル部分の炭素数が 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフリルアルキル基なる群から選ばれた基を 1 ~ 3 個有することのあるピペリジニルカルボニル基を例示できる。

10

【0236】

チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニル低級アルカノイル基としては、例えば、2 - [(2, 3, 4 又は 5 -) チアゾリジニル] アセチル、3 - [(2, 3, 4 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピオニル、2 - [(2, 3, 4 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピオニル、4 - [(2, 3, 4 又は 5 -) チアゾリジニル] ブチリル、5 - [(2, 3, 4 又は 5 -) 1, 2, 4 - チアゾリジニル] ペンタノイル、6 - [(2, 3, 4 又は 5 -) チアゾリジニル] ヘキサノイル、2, 2 - ジメチル - 3 - [(2, 3, 4 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピオニル、2 - メチル - 3 - [(2, 3, 4 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピオニル、2, 4 - ジオキソ - (3 又は 5 -) チアゾリジニルアセチル、3 - [2 - オキソ - (3, 4 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピオニル、2 - [4 - オキソ - (2, 3 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピオニル、4 - [5 - オキソ - (2, 3 又は 4 -) チアゾリジニル] ブチリル、5 - [2, 5 - ジオキソ - (3 又は 4 -) チアゾリジニル] ペンタノイル、6 - [2, 4, 5 - トリオキソ - 3 - チアゾリジニル] ヘキサノイル、2 - [4, 5 - ジオキソ - (2 又は 3 -) チアゾリジニル] アセチル、2, 2 - ジメチル - 3 - [2, 4 - ジオキソ - (3 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピオニル、2 - メチル - 3 - [2, 4 - ジオキソ - (3 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピオニル基等のチアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を 1 ~ 3 個有することがあり、アルカノイル部分が炭素数 2 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるチアゾリジニルアルカノイル基を例示できる。

20

【0237】

ピペリジン環上に低級アルコキシカルボニル基、フェニル低級アルキル基、低級アルキル基、ベンゾイル基及びフリル低級アルキル基なる群から選ばれた基が置換していてもよいピペリジニル基としては、例えば、(1, 2, 3 又は 4 -) ピペリジニル、1 - ベンジル - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニル、1 - (2 又は 3 -) フリルメチル - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニル、1 - (2 - フェニルエチル) - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニル、1 - { 2 - [(1 又は 2 -) フリル] エチル } - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニル、1 - (1 - フェニルエチル) - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニル、1 - { 3 - [(1 又は 2 -) フリル] プロピル] } - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニル、1 - (3 - フェニルプロピル) - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニル、1 - { 1 - [(1 又は 2 -) フリル] エチル] } - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニル、1 - (4 - フェニルブチル) - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニル、1 - { 4 - [(1 又は 2 -) フリル] ブチル] } - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニル、1 - (5 - フェニルペンチル) - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニル、1 - { 5 - [(1 又は 2 -) フリル] ペンチル] } - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニル、1 - (6 - フェニルヘキシル) - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニル、1 - { 6 - [(1 又は 2 -) フリル] ヘキシル] } - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニル、1, 2 - ジベンジル - (3, 4, 5 又は 6 -) ピペリジニル、1, 3 - ジ (1 又は 2 -) フリルメチル - (2, 4, 5 又は 6 -) ピペリジニル、1, 3, 5 - トリベンジル - (2, 4 又は 6 -) ピペリジニル、1, 2, 6 - トリ (1 又は 2 -) フリルメチル - (3, 4 又は 5 -) ピペリジニル、1 - ベンジル - 3 - (1 又は 2 -) フリルメチル - (2, 4, 5 又は 6 -) ピペリジニル、1 - { 1 - [(1 又は 2 -) フリル] エチル] } - (2, 3 又は 4 -) ピペリジニル

30

40

50

、 1 - ベンゾイル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 , 2 - ジベンゾイル - (3 , 4 , 5 又は 6 -) ピペリジニル、 1 , 3 , 5 - トリベンゾイル - (2 , 4 又は 6 -) ピペリジニル、 1 - メチル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 - エチル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 - プロピル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 - イソプロピル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 - ブチル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 - イソブチル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 - tert - ブチル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 - ペンチル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 - ヘキシル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 , 2 - ジメチル - (3 , 4 , 5 又は 6 -) ピペリジニル、 1 , 2 , 6 - トリメチル - (3 , 4 又は 5 -) ピペリジニル、 1 - メチル - 3 - ベンジル - (3 , 4 , 5 又は 6 -) ピペリジニル、 1 - ベンゾイル - 2 - メチル - (2 , 4 , 5 又は 6 -) ピペリジニル、 1 - (1 又は 2 -) フリルメチル - 2 , 4 - ジメチル - (3 , 5 又は 6 -) ピペリジニル、 1 - メトキシカルボニル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 - エトキシカルボニル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 - プロポキシカルボニル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 - ブトキシカルボニル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 - tert - ブトキシカルボニル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 - ペンチルオキシカルボニル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 - ヘキシルオキシカルボニル - (2 , 3 又は 4 -) ピペリジニル、 1 , 2 - ジメトキシカルボニル - (3 , 4 , 5 又は 6 -) ピペリジニル、 1 , 2 , 6 - トリエトキシカルボニル - (3 , 4 又は 5 -) ピペリジニル、 1 - メチル - 3 - tert - ブトキシカルボニル - (3 , 4 , 5 又は 6 -) ピペリジニル、 1 - ベンゾイル - 2 - メトキシカルボニル - (2 , 4 , 5 又は 6 -) ピペリジニル、 1 - (1 又は 2 -) フリルメチル - 2 , 4 - ジメトキシカルボニル - (3 , 5 又は 6 -) ピペリジニル、 1 - ベンジル - 2 , 4 - ジメトキシカルボニル - (3 , 5 又は 6 -) ピペリジニル基等のピペリジン環上にアルコキシ部分の炭素数が 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるアルコキシカルボニル基、アルキル部分の炭素数が 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基、炭素数が 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、ベンゾイル基及びアルキル部分の炭素数が 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフリルアルキル基なる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよいピペリジニル基を例示できる。

10

20

30

40

【 0 2 3 8 】

基

【 0 2 3 9 】

【 化 5 4 】



【 0 2 4 0 】

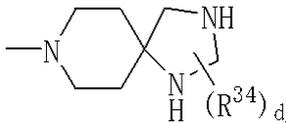
(以下、この基を「 A 基」という) が置換したカルボニル低級アルキル基としては、例えば、 A 基置換カルボニルメチル、 2 - A 基置換カルボニルエチル、 1 - A 基置換カルボニルエチル、 3 - A 基置換カルボニルプロピル、 4 - A 基置換カルボニルブチル、 1 , 1 - ジメチル - 2 - A 基置換カルボニルエチル、 5 - A 基置換カルボニルペンチル、 6 - A 基置換カルボニルヘキシル、 1 - A 基置換カルボニルイソプロピル、 2 - メチル - 3 - A 基置換カルボニルプロピル基等のアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である A 基置換カルボニルアルキル基を例示できる。

【 0 2 4 1 】

基

【 0 2 4 2 】

【化 5 5】



【 0 2 4 3】

(R^{34} はオキソ基又はフェニル基を示す。d は 0 ~ 3 の整数を示す。) (以下、この基を「B 基」という) が置換したカルボニル低級アルキル基としては、例えば、B 基置換カルボニルメチル、2 - B 基置換カルボニルエチル、1 - B 基置換カルボニルエチル、3 - B 基置換カルボニルプロピル、4 - B 基置換カルボニルブチル、1, 1 - ジメチル - 2 - B 基置換カルボニルエチル、5 - B 基置換カルボニルペンチル、6 - B 基置換カルボニルヘキシル、1 - B 基置換カルボニルイソプロピル、2 - メチル - 3 - B 基置換カルボニルプロピル基等のアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である B 基置換カルボニルアルキル基を例示できる。

10

【 0 2 4 4】

ピロリジニル低級アルキル基としては、例えば、(1 -、2 - 又は 3 -) ピロリジニルメチル、2 - [(1 -、2 - 又は 3 -) ピロリジニル] エチル、1 - [(1 -、2 - 又は 3 -) ピロリジニル] エチル、3 - [(1 -、2 - 又は 3 -) ピロリジニル] プロピル、4 - [(1 -、2 - 又は 3 -) ピロリジニル] ブチル、5 - [(1 -、2 - 又は 3 -) ピロリジニル] ペンチル、6 - [(1 -、2 - 又は 3 -) ピロリジニル] ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [(1 -、2 - 又は 3 -) ピロリジニル] エチル、2 - メチル - 3 - [(1 -、2 - 又は 3 -) ピロリジニル] プロピル基等のアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピロリジニルアルキル基を挙げることができる。

20

【 0 2 4 5】

モルホリノ低級アルキル基としては、例えば、(2 -、3 - 又は 4 -) モルホリノメチル、2 - [(2 -、3 - 又は 4 -) モルホリノ] エチル、1 - [(2 -、3 - 又は 4 -) モルホリノ] エチル、3 - [(2 -、3 - 又は 4 -) モルホリノ] プロピル、4 - [(2 -、3 - 又は 4 -) モルホリノ] ブチル、5 - [(2 -、3 - 又は 4 -) モルホリノ] ペンチル、6 - [(2 -、3 - 又は 4 -) モルホリノ] ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [(2 -、3 - 又は 4 -) モルホリノ] エチル、2 - メチル - 3 - [(2 -、3 - 又は 4 -) モルホリノ] プロピル基等のアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるモルホリノアルキル基を挙げることができる。

30

【 0 2 4 6】

フェニル低級アルケニル基としては、例えば、スチリル、3 - フェニル - 2 - プロペニル基 (慣用名: シンナミル基)、4 - フェニル - 2 - ブテニル基、4 - フェニル - 3 - ブテニル基、5 - フェニル - 4 - ペンテニル基、5 - フェニル - 3 - ペンテニル基、6 - フェニル - 5 - ヘキセニル基、6 - フェニル - 4 - ヘキセニル基、6 - フェニル - 3 - ヘキセニル基、4 - フェニル - 1, 3 - ブタジエニル基、6 - フェニル - 1, 3, 5 - ヘキサトリエニル基等のアルケニル部分が炭素数 2 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状のアルケニル基であり、二重結合を 1 ~ 3 個有するフェニルアルケニル基を例示できる。

40

【 0 2 4 7】

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるアニリノカルボニル低級アルキル基としては、アニリノカルボニルメチル、2 - アニリノカルボニルエチル、1 - アニリノカルボニルエチル、3 - アニリノカルボニルプロピル、4 - アニリノカルボニルブチル、5 - アニリノカルボニルペンチル、6 - アニリノカルボニルヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - アニリノカルボニルエチル、2 - メチル - 3 - アニリノカルボニルプロピル、(4 - メチルアニリノカルボニル) メチル、2 - (3 - メチルアニリノカルボニル) エチル、3 - (4 - メチルアニリノカルボニル) プロピル、1 - (2 - エチルアニリノカルボニル) エチル、4 - (3 - エチルアニリノカルボニル) ブチル、5 - (4 - エチルアニリノカルボニル) ペンチル、6 - (4 - イソプロピルアニリノカルボニル) ヘキシル

50

、 1 , 1 - ジメチル - 2 - (3 - ブチルアニリノカルボニル) エチル、 2 - メチル - 3 - (4 - ペンチルアニリノカルボニル) プロピル、 4 - ヘキシルアニリノカルボニルメチル、 3 , 4 - ジメチルアニリノカルボニルメチル、 3 , 4 - ジエチルアニリノカルボニルメチル、 2 , 4 - ジメチルアニリノカルボニルメチル、 2 , 5 - ジメチルアニリノカルボニルメチル、 2 , 6 - ジメチルアニリノカルボニルメチル、 3 , 4 , 5 - トリメチルアニリノカルボニルメチル基等のアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、フェニル環上に置換基として炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1 ~ 3 個有することのあるアニリノカルボニルアルキル基を例示できる。

【 0 2 4 8 】

ピペラジン環上に置換基として低級アルキル基及びフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるピペラジニル低級アルキル基としては、例えば、 [(1 - 、 2 - 又は 3 -) ピペラジニル] メチル、 2 - [(1 - 、 2 - 又は 3 -) ピペラジニル] エチル、 1 - [(1 - 、 2 - 又は 3 -) ピペラジニル] エチル、 3 - [(1 - 、 2 - 又は 3 -) ピペラジニル] プロピル、 4 - [(1 - 、 2 - 又は 3 -) ピペラジニル] ブチル、 5 - [(1 - 、 2 - 又は 3 -) ピペラジニル] ペンチル、 6 - [(1 - 、 2 - 又は 3 -) ピペラジニル] ヘキシル、 1 , 1 - ジメチル - 2 - [(1 - 、 2 - 又は 3 -) ピペラジニル] エチル、 2 - メチル - 3 - [(1 - 、 2 - 又は 3 -) ピペラジニル] プロピル、 [1 - メチル - (2 - 、 3 - 又は 4 -) ピペラジニル] メチル、 2 - [1 - エチル - (2 - 、 3 - 又は 4 -) ピペラジニル] エチル、 1 - [4 - プロピル - (1 - 、 2 - 、 又は 3 -) ピペラジニル] エチル、 3 - [3 - イソプロピル - (1 - 、 2 - 、 4 - 、 5 - 又は 6 -) ピペラジニル] プロピル、 4 - [2 - ブチル - (1 - 、 3 - 、 4 - 、 5 - 又は 6 -) ピペラジニル] ブチル、 5 - [1 - イソブチル - (2 - 、 3 - 又は 4 -) ピペラジニル] ペンチル、 3 - [4 - メチル - (1 - 、 2 - 、 又は 3 -) ピペラジニル] プロピル、 6 - [1 - tert - ブチル - (2 - 、 3 - 又は 4 -) ピペラジニル] ヘキシル、 1 , 1 - ジメチル - 2 - [4 - ペンチル - (1 - 、 2 - 又は 3 -) ピペラジニル] エチル、 [1 , 2 - ジメチル - (3 - 、 4 - 又は 5 -) ピペラジニル] メチル、 [1 , 2 , 6 - トリメチル - (3 - 、 4 - 又は 5 -) ピペラジニル] メチル、 2 - [4 - (3 , 4 - メチレンジオキシベンジル) - (1 - 、 2 - 又は 3 -) ピペラジニル] エチル基等のアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、ピペラジン環上に置換基として炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びフェニル環上に置換基として炭素数 1 ~ 4 の直鎖又は分枝鎖状アルキレンジオキシ基を有することがあり、アルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基なる群から選ばれた基を 1 ~ 3 個有することのあるピペラジニルアルキル基を例示できる。

【 0 2 4 9 】

置換基として低級アルキル基を有することのあるアミジノ低級アルキル基としては、例えばアミジノメチル、 2 - アミジノエチル、 1 - アミジノエチル、 3 - アミジノプロピル、 4 - アミジノブチル、 5 - アミジノペンチル、 6 - アミジノヘキシル、 1 , 1 - ジメチル - 2 - アミジノエチル、 2 - メチル - 3 - アミジノプロピル、 N , N - ジメチルアミジノメチル、 2 - (N , N - ジメチルアミジノ) エチル、 1 - (N - メチルアミジノ) エチル、 3 - (N - エチルアミジノ) プロピル、 4 - (N - n - プロピルアミジノ) プロピル、 5 - (N - n - ペンチルアミジノ) ペンチル、 6 - (N - n - ヘキシルアミジノ) ヘキシル、 (N - メチル - N - エチルアミジノ) メチル基等のアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1 ~ 2 個有することのあるアミジノアルキル基を例示できる。

【 0 2 5 0 】

カルバゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるカルバゾリル基としては、例えば、 (1 - 、 2 - 、 3 - 又は 4 -) カルバゾリル、 9 - メチル - (1 - 、 2 - 、 3 - 又は 4 -) カルバゾリル、 9 - エチル - (1 - 、 2 - 、 3 - 又は 4 -) カルバゾリル、 1 - エチル - (2 - 、 3 - 、 4 - 、 5 - 、 6 - 、 7 - 、 8 - 又は 9 -) カルバゾリ

10

20

30

40

50

ル、2-n-プロピル-(1-、3-、4-、5-、6-、8-又は9-)カルバゾリル、3-n-ブチル-(1-、2-、4-、5-、6-、7-、8-又は9-)カルバゾリル、4-n-ペンチル-(1-、2-、3-、5-、6-、7-、8-又は9-)カルバゾリル、5-n-ヘキシル-(1-、2-、3-、4-、6-、7-、8-又は9-)カルバゾリル、6,9-ジメチル-(1-、2-、3-、4-、5-、7-又は8-)カルバゾリル、1,7,8-トリチル-(2-、3-、4-、5-、6-、7-、8-又は9-)カルバゾリル基等のカルバゾール環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~3個有することのあるカルバゾリル基を例示できる。

【0251】

置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミノ基、N,N-ジメチルアミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-n-プロピルアミノ基、N-n-ブチルアミノ基、N-n-ペンチルアミノ基、N-n-ヘキシルアミノ基、N,N-ジエチルアミノ基、N-メチル-N-エチルアミノ基等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基を例示できる。

フェニル低級アルキル基(フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基及び低級アルコキシ基なる群から選ばれた基1~3個有していてもよい)としては、例えば、前記フェニル低級アルキル基に加えて、3,4-メチレンジオキシベンジル、3,4-トリメチレンジオキシベンジル、2-(2,3-エチレンジオキシフェニル)エチル、1-(3,4-トリメチレンジオキシフェニル)エチル、3-(2,3-テトラメチレンジオキシフェニル)プロピル、4-(3,4-メチレンジオキシフェニル)ブチル、5-(2,3-エチレンジオキシフェニル)ペンチル、6-(3,4-トリメチレンジオキシフェニル)ヘキシル、1,1-ジメチル-2-(2,3-メチレンジオキシフェニル)エチル、2-メチル-3-(3,4-エチレンジオキシフェニル)プロピル、2-メトキシベンジル、2-(2-メトキシフェニル)エチル、2-(3-メトキシフェニル)エチル、2-(4-メトキシフェニル)エチル、4-メトキシベンジル、1-(2-エトキシフェニル)エチル、3-(3-エトキシフェニル)プロピル、4-(4-エトキシフェニル)ブチル、5-(4-イソプロポキシフェニル)ペンチル、6-(3-プトキシフェニル)ヘキシル、1,1-ジメチル-2-(4-ペンチルオキシフェニル)エチル、2-メチル-3-(4-ヘキシルオキシフェニル)プロピル、3,4-ジメトキシベンジル、3,4-ジエトキシベンジル、2,4-ジメトキシベンジル、2,5-ジメトキシベンジル、2,6-ジメトキシベンジル、3,4,5-トリメトキシベンジル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基(フェニル環上に置換基として炭素数1~4の直鎖又は分枝鎖状アルキレンジオキシ基及び炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基なる群から選ばれた基1~3個有していてもよい)を例示できる。

【0252】

ピペラジン環上に置換基としてフェニル低級アルキル基(フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基及び低級アルコキシ基なる群から選ばれた基1~3個有していてもよい)及びピリジル低級アルキル基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるピペラジニル置換オキサリル基としては、例えば、4-(3,4-メチレンジオキシベンジル)-(1-、2-又は3-)ピペラジニルオキサリル、4-(2-、3-又は4-ピリジルメチル)-(1-、2-又は3-)ピペラジニルオキサリル、4-(3,4-ジメトキシベンジル)-(1-、2-又は3-)ピペラジニルオキサリル、4-(2,3-メチレンジオキシベンジル)-(1-、2-又は3-)ピペラジニルオキサリル、4-(3,4-エチレンジオキシベンジル)-(1-、2-又は3-)ピペラジニルオキサリル、4-[2-(2-、3-又は4-ピリジル)エチル]-(1-、2-又は3-)ピペラジニルオキサリル、4-[3-(2-、3-又は4-ピリジル)プロピル]-(1-、2-又は3-)ピペラジニルオキサリル、2,4-ビス(2-、3-又は4-ピリジルメチル)-(1-、2-又は3-)ピペラジニルオキサリル、2-(3,4-メチレンジオキシ

10

20

30

40

50

ベンジル) - 4 - (2 - 、 3 - 又は 4 - ピリジルメチル) - (1 - 、 2 - 又は 3 -) ピペラジニルオキサリル、 2 , 3 , 4 - トリ (2 - 、 3 - 又は 4 - ピリジルメチル) - (1 - 、 2 - 又は 3 -) ピペラジニルオキサリル基等のピペラジン環上に置換基としてアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基 (フェニル環上に置換基として炭素数 1 ~ 4 の直鎖又は分枝鎖状アルキレンジオキシ基及び炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基なる群から選ばれた基 1 ~ 3 個有していてもよい) 及びアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピリジルアルキル基なる群から選ばれた基を 1 ~ 3 個有することのあるピペラジニル置換オキサリル基を例示できる。

【 0 2 5 3 】

シアノ置換低級アルキル基としては、シアノメチル、 2 - シアノエチル、 1 - シアノエチル、 3 - シアノプロピル、 4 - シアノブチル、 5 - シアノペンチル、 6 - シアノヘキシル、 1 , 1 - ジメチル - 2 - シアノエチル、 2 - メチル - 3 - シアノプロピル基等のアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるシアノアルキル基を挙げることができる。

【 0 2 5 4 】

$R^{3,6}$ 及び $R^{3,7}$ が結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成される 5 ~ 7 員の飽和複素環基としては、例えば、ピロリジニル、ペペリジニル、ピペラジニル、モルホリノ、チオモルホリノ、ホモピペラジニル基等を例示できる。

【 0 2 5 5 】

$R^{1,4}$ と $R^{1,5}$ とが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成される 5 ~ 10 員の飽和又は不飽和複素環基としては、例えば、 1 , 2 , 3 , 4 , 5 , 6 - ヘキサヒドロピリミジニル、ピロリジニル、ペペリジニル、ピペラジニル、モルホリノ、チオモルホリノ、ホモピペラジニル、ホモペペリジニル、チアゾリジニル、 1 , 2 , 5 , 6 - テトラヒドロピリジニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、 2 - ピロリニル、 2 - イミダゾリニル、イミダゾリジニル、 2 - ピラゾリニル、ピラゾリジニル、 1 , 2 - ジヒドロピリジニル、 1 , 2 - ジヒドロキノリル、 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリル、 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリル、 1 , 2 - ジヒドロイソキノリル、インドリル、イソインドリル、インドリニル、イソインドリニル、 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾオキサジニル、 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 1 , 4 - ベンゾチアゾリジニル、 1 , 4 - ベンゾチアジニル、 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノキサリニル、 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロシンノリニル、 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロフタラジニル、 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキナゾリニル、 1 , 2 - ジヒドロキノキサリニル、 3 , 4 - ジヒドロキノキサリニル、 1 , 4 - ジヒドロキノキサリニル、 1 , 2 - ジヒドロシンノリニル、 1 , 2 - ジヒドロフタラジニル、 3 , 4 - ジヒドロフタラジニル、 1 , 2 - ジヒドロキナゾリニル、 3 , 4 - ジヒドロキナゾリニル、インダゾリル、インダゾリニル、 6 - アザピシクロ [3 , 2 , 1] オクチル、 3 - アザ - スピロ [5 , 5] ウンデシル、チアゾリジニル基等を例示できる。

好ましくは、 $R^{1,4}$ および $R^{1,5}$ が、それらが結合する窒素原子と共に、窒素原子を介し又は介することなく互いに結合して形成される 6 員の飽和複素環基であり、最も好ましくは、ペペリジニル基、ピペラジニル基を挙げることができる。

【 0 2 5 6 】

フェニル低級アルコキシ基としては、例えば、ベンジルオキシ、 2 - フェニルエトキシ、 1 - フェニルエトキシ、 3 - フェニルプロポキシ、 4 - フェニルブトキシ、 5 - フェニルペンチルオキシ、 6 - フェニルヘキシルオキシ、 1 , 1 - ジメチル - 2 - フェニルエトキシ、 2 - メチル - 3 - フェニルプロポキシ基等のアルコキシ部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシ基を挙げることができる。

【 0 2 5 7 】

フェニル環上に置換基として低級アルカノイル基、置換基として低級アルカノイル基を

10

20

30

40

50

有することのあるアミノ基、低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基及び低級アルキレンジオキシ基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよいフェニルを1～2個有し、低級アルキル基上にピリジル基を有することのあるフェニル置換低級アルキル基としては、例えば、前記フェニル低級アルキル基に加え、1 - フェニル - 1 - (2, 3又は4 -)ピリジルメチル、1, 1 - ジフェニルメチル、1, 1 - ジ(4 - フルオロフェニル)メチル、1 - フェニル - 1 - (4 - メトキシフェニル)メチル、3, 4 - メチレンジオキシベンジル、3, 4 - エチレンジオキシベンジル、3, 4 - トリメチレンジオキシベンジル、2, 5 - ジフルオロベンジル、2, 4 - ジフルオロベンジル、3, 4 - ジフルオロベンジル、3, 5 - ジフルオロベンジル、2, 6 - ジフルオロベンジル、3 - トリフルオロメチルベンジル、2 - トリフルオロメチルベンジル、4 - トリフルオロメチルベンジル、3, 4 - ジメトキシベンジル、3, 5 - ジメトキシベンジル、2 - クロロベンジル、3 - クロロベンジル、4 - クロロベンジル、2 - メチルベンジル、3 - メチルベンジル、4 - メチルベンジル、3, 4 - ジメチルベンジル、2, 3 - ジメチルベンジル、2 - メトキシベンジル、3 - メトキシベンジル、4 - シアノベンジル、2 - シアノベンジル、3 - シアノベンジル、4 - メトキシベンジル、2, 3 - ジクロロベンジル、2, 4 - ジクロロベンジル、2, 5 - ジクロロベンジル、3, 4 - ジクロロベンジル、2, 6 - ジクロロベンジル、4 - フルオロベンジル、3 - フルオロベンジル、2 - フルオロベンジル、4 - ニトロベンジル、3 - ニトロベンジル、2 - ニトロベンジル、3 - トリフルオロメトキシベンジル、4 - トリフルオロメトキシベンジル、2 - トリフルオロメトキシベンジル、4 - メトキシカルボニルベンジル、3 - メトキシカルボニルベンジル、4 - tert - ブチルベンジル、4 - エチルベンジル、4 - イソプロピルベンジル、4 - メトキシ - 3 - クロロベンジル、2 - (4 - メトキシフェニル)エチル、2 - (4 - フルオロフェニル)エチル、2 - (4 - クロロフェニル)エチル、2 - (3 - メトキシフェニル)エチル、2 - (4 - メチルフェニル)エチル、4 - フェニルベンジル、3, 3 - ジフェニルプロピル、3 - メチル - 4 - ニトロベンジル、4 - (4 - メトキシフェニル)ブチル、2 - (4 - メチルフェニル)エチル、4 - tert - ブトキシカルボニルベンジル、3 - クロロ - 6 - メトキシベンジル、4 - アセチルアミノベンジル、4 - ニトロ - 3 - メチルベンジル、4 - ヒドロキシベンジル、3 - ヒドロキシベンジル、2 - ヒドロキシベンジル、4 - tert - ブチルベンジル、4 - ベンジルオキシベンジル、4 - ビバロイルベンジル、2 - (4 - アセチルフェニル)エチル、1 - (3 - プロピオニルフェニル)エチル、3 - (2 - ブチルフェニル)プロピル、4 - (4 - ペンタノイルフェニル)ブチル、5 - (3 - ヘキサノイルフェニル)ペンチル、6 - (2, 4 - ジアセチルフェニル)ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - (2, 4, 6 - トリアセチルフェニル)エチル、2 - メチル - 3 - (3, 4 - ジアセチルフェニル)プロピル、2 - (4 - アミノフェニル)エチル、1 - (3 - プロピオニルアミノフェニル)エチル、3 - (2 - ブチルアミノフェニル)プロピル、4 - (4 - ペンタノイルアミノ)フェニルブチル、5 - (ヘキサノイルアミノフェニル)ペンチル、6 - (N - アセチル - N - プロピオニルアミノフェニル)ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - (3, 4 - ジアミノフェニル)エチル、2 - メチル - 3 - (3, 4, 5 - トリアセチルアミノフェニル)プロピル、2 - (2 - エトキシカルボニルフェニル)エチル、1 - (3 - プロポキシカルボニルフェニル)エチル、3 - (4 - ペンチルオキシカルボニルフェニル)プロピル、4 - (3 - ヘキシロオキシカルボニルフェニル)ブチル、5 - (3, 4 - ジメトキシカルボニルフェニル)ペンチル、6 - (3, 4, 5 - トリエトキシカルボニルフェニル)ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - (4 - ブトキシカルボニルフェニル)エチル、2 - メチル - 3 - (4 - メトキシカルボニルフェニル)プロピル、2 - (2 - シアノフェニル)エチル、1 - (3 - シアノフェニル)エチル、3 - (4 - シアノフェニル)プロピル、4 - (2 - シアノフェニル)ブチル、5 - (3 - シアノフェニル)ペンチル、6 - (4 - シアノフェニル)ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - (2, 4 - ジシアノフェニル)エチル、2 - メチル - 3 - (2, 4, 6 - トリシア

ノフェニル)プロピル、2-(2-ニトロフェニル)エチル、1-(3-ニトロフェニル)エチル、3-(4-ニトロフェニル)プロピル、4-(2-ニトロフェニル)ブチル、5-(3-ニトロフェニル)ペンチル、6-(4-ニトロフェニル)ヘキシル、1,1-ジメチル-2-(2,4-ジニトロフェニル)エチル、2-メチル-3-(2,4,6-トリニトロフェニル)プロピル、2-(2-フェニルフェニル)エチル、1-(3-フェニルフェニル)エチル、3-(4-フェニルフェニル)プロピル、4-(2-フェニルフェニル)ブチル、5-(3-フェニルフェニル)ペンチル、6-(4-フェニルフェニル)ヘキシル、1,1-ジメチル-2-(2,4-ジフェニルフェニル)エチル、2-メチル-3-(2,4,6-トリフェニルフェニル)プロピル、2-(2-フルオロフェニル)エチル、1-(3-プロモフェニル)エチル、3-(4-ヨードフェニル)プロピル、4-(2-プロモフェニル)ブチル、5-(3-クロロフェニル)ペンチル、6-(4-プロモフェニル)ヘキシル、1,1-ジメチル-2-(2,4-ジクロロフェニル)エチル、2-メチル-3-(2,4,6-トリフルオロフェニル)プロピル、2-(2-エチルフェニル)エチル、1-(3-プロピルフェニル)エチル、3-(4-ブチルフェニル)プロピル、4-(2-ペンチルフェニル)ブチル、5-(3-ヘキシルフェニル)ペンチル、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル、1,1-ジメチル-2-(2,4-ジメチルフェニル)エチル、2-メチル-3-[2,4,6-トリ(トリフルオロメチル)フェニル]プロピル、2-(2-エトキシフェニル)エチル、1-(3-プロボキシフェニル)エチル、3-(4-プトキシフェニル)プロピル、4-(2-ペンチルオキシフェニル)ブチル、5-(3-ヘキシルオキシフェニル)ペンチル、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル、1,1-ジメチル-2-(2,4-ジメトキシフェニル)エチル、2-メチル-3-[2,4,6-トリ(トリフルオロメトキシ)フェニル]プロピル、2-(2-ベンジルオキシフェニル)エチル、1-[3-(2-フェニルエトキシ)フェニル]エチル、3-[4-(3-フェニルプロボキシ)フェニル]プロピル、4-[2-(4-フェニルプトキシ)フェニル]ブチル、5-[3-(5-フェニルペンチルオキシ)フェニル]ペンチル、6-[4-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル]ヘキシル、1,1-ジメチル-2-(2,4-ジベンジルオキシフェニル)エチル、2-メチル-3-(2,4,6-トリベンジルオキシフェニル)プロピル、2-(2-ヒドロキシフェニル)エチル、1-(3-ヒドロキシフェニル)エチル、3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピル、4-(2-ヒドロキシフェニル)ブチル、5-(3-ヒドロキシフェニル)ペンチル、6-(4-ヒドロキシフェニル)ヘキシル、1,1-ジメチル-2-(2,4-ジヒドロキシフェニル)エチル、2-メチル-3-(2,4,6-トリヒドロキシフェニル)プロピル、2-(3,4-メチレンジオキシフェニル)エチル、1-(2,3-エチレンジオキシフェニル)エチル、3-(3,4-トリメチレンジオキシフェニル)プロピル、4-(3,4-テトラメチレンジオキシフェニル)ブチル、5-(3,4-メチレンジオキシフェニル)ペンチル、6-(3,4-エチレンジオキシフェニル)ヘキシル、1,1-ジメチル-2-(3,4-メチレンジオキシ)エチル、2-メチル-3-(3,4-メチレンジオキシフェニル)プロピル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基、置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を1~2個有することのあるアミノ基、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、置換基としてハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、アルコキシ部分の炭素数が1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシ基、水酸基及び炭素数1~4の直鎖又は分枝鎖状アルキレンジオキシ基なる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよいフェニルを1~2個有し、アルキル基上にピリジル基を有することのあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニル置換アルキル基を例示できる。

10

20

30

40

好ましくは、フェニル環上に置換基として低級アルカノイル基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニト

50

ロ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基及び低級アルキレンジオキシ基からなる群から選ばれた基が置換していてもよいフェニル置換低級アルキル基を挙げることができる。

【0258】

ピリジン環上に置換基として水酸基及び置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基を1～3個有することのあるピリジル低級アルキル基としては、例えば、前記ピリジル低級アルキル基に加えて、[2-メチル-(3,4,5又は6-)ピリジル]メチル、[2-メチル-3-ヒドロキシ-5-ヒドロキシメチル-(4又は6-)ピリジル]メチル、2-[3-エチル-(2,4,5又は6-)ピリジル]エチル、1-[4-プロピル-(2,3,5又は6-)ピリジル]エチル、3-[2-ブチル-(3,4,5又は6-)ピリジル]プロピル、4-[3-ペンチル-(2,4,5又は6-)ピリジル]ブチル、1,1-ジメチル-2-[4-ヘキシル-(2,3,5又は6-)ピリジル]エチル、5-[2,3-ジメチル-(4,5又は6-)ピリジル]ペンチル、6-[2,4,6-トリメチル-(3又は5-)ピリジル]ヘキシル、1-[2-ヒドロキシ-(2,3,5又は6-)ピリジル]イソプロピル、2-メチル-3-[3-ヒドロキシ-(2,4,5又は6-)ピリジル]プロピル、[2-ヒドロキシ-(3,4,5又は6-)ピリジル]メチル、2-[3-ヒドロキシ-(2,4,5又は6-)ピリジル]エチル、1-[4-ヒドロキシ-(2,3,5又は6-)ピリジル]エチル、3-[2-ヒドロキシ-(3,4,5又は6-)ピリジル]プロピル、4-[3-ヒドロキシ-(2,4,5又は6-)ピリジル]ブチル、1,1-ジメチル-2-[4-ヒドロキシ-(2,3,5又は6-)ピリジル]エチル、5-[2,3-ジヒドロキシ-(4,5又は6-)ピリジル]ペンチル、6-[2,4,6-トリヒドロキシ-(3又は5-)ピリジル]ヘキシル、[2-ヒドロキシメチル-(3,4,5又は6-)ピリジル]メチル、2-[3-(2-ヒドロキシエチル)-(2,4,5又は6-)ピリジル]エチル、1-[4-(3-ヒドロキシプロピル)-(2,3,5又は6-)ピリジル]エチル、3-[2-(4-ヒドロキシブチル)-(3,4,5又は6-)ピリジル]プロピル、4-[3-(5-ヒドロキシペンチル)-(2,4,5又は6-)ピリジル]ブチル、1,1-ジメチル-2-[4-(6-ヒドロキシヘキシル)-(2,3,5又は6-)ピリジル]エチル、5-[2,3-ジ(ヒドロキシメチル)-(4,5又は6-)ピリジル]ペンチル、6-[2,4,6-トリ(ヒドロキシメチル)-(3又は5-)ピリジル]ヘキシル、1-[2-ヒドロキシメチル-(2,3,5又は6-)ピリジル]イソプロピル、2-メチル-3-[3-(2,3-ジヒドロキシプロピル)-(2,4,5又は6-)ピリジル]プロピル、[2-メチル-3-(2,2,4-トリヒドロキシブチル)-(4,5又は6-)ピリジル]メチル、[2-メチル-5-ヒドロキシメチル-(3,4又は6-)ピリジル]メチル基等のピリジン環上に置換基として水酸基及び置換基として水酸基を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群から選ばれた基を1～3個有することがあり、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピリジルアルキル基を例示できる。

【0259】

ピロール環上に置換基として低級アルキル基を1～3個有することのあるピロリル低級アルキル基としては、例えば、[(1,2又は3-)ピロリル]メチル、2-[(1,2又は3-)ピロリル]エチル、1-[(1,2又は3-)ピロリル]エチル、3-[(1,2又は3-)ピロリル]プロピル、4-[(1,2又は3-)ピロリル]ブチル、5-[(1,2又は3-)ピロリル]ペンチル、6-[(1,2又は3-)ピロリル]ヘキシル、1,1-ジメチル-2-[(1,2又は3-)ピロリル]エチル、2-メチル-3-[(1,2又は3-)ピロリル]プロピル、[1-メチル-(2又は3-)ピロリル]メチル、2-[2-エチル-(1,3,4又は5-)ピロリル]エチル、1-[3-プロピル-(1,2,4又は5-)ピロリル]エチル、3-[1-ブチル-(2,3又は4-)ピロリル]プロピル、4-[2-ペンチル-(1,3,4又は5-)ピロリル]ブチル、

5 - [3 - ヘキシル - (1 , 2 , 4 又は 5 -) ピロリル] ペンチル、6 - [1 , 2 - ジメチル - (3 , 4 又は 5 -) ピロリル] ヘキシル、1 , 1 - ジメチル - 2 - [1 , 2 , 3 - トリメチル - (4 又は 5 -) ピロリル] エチル、2 - メチル - 3 - [1 - エチル - 2 - メチル - (3 , 4 又は 5 -) ピロリル] プロピル基等のピロール環上に置換基として炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1 ~ 3 個有することがあり、アルキル部分が炭素数が 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピロリルアルキル基を例示できる。

【 0 2 6 0 】

ベンゾオキサゾリル低級アルキル基としては、例えば、[(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾオキサゾリル] メチル、2 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾオキサゾリル] エチル、1 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾオキサゾリル] エチル、3 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾオキサゾリル] プロピル、4 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾオキサゾリル] ブチル、5 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾオキサゾリル] ペンチル、6 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾオキサゾリル] ヘキシル、1 , 1 - ジメチル - 2 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾオキサゾリル] エチル、2 - メチル - 3 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾオキサゾリル] プロピル等のアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるベンゾオキサゾリルアルキル基を例示できる。

10

【 0 2 6 1 】

ベンゾチアゾリル低級アルキル基としては、例えば、[(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾチアゾリル] メチル、2 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾチアゾリル] エチル、1 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾチアゾリル] エチル、3 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾチアゾリル] プロピル、4 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾチアゾリル] ブチル、5 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾチアゾリル] ペンチル、6 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾチアゾリル] ヘキシル、1 , 1 - ジメチル - 2 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾチアゾリル] エチル、2 - メチル - 3 - [(2 , 4 , 5 , 6 又は 7 -) ベンゾチアゾリル] プロピル等のアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるベンゾチアゾリルアルキル基を例示できる。

20

【 0 2 6 2 】

フリル低級アルキル基としては、例えば、[(2 又は 3 -) フリル] メチル、2 - [(2 又は 3 -) フリル] エチル、1 - [(2 又は 3 -) フリル] エチル、3 - [(2 又は 3 -) フリル] プロピル、4 - [(2 又は 3 -) フリル] ブチル、5 - [(2 又は 3 -) フリル] ペンチル、6 - [(2 又は 3 -) フリル] ヘキシル、1 , 1 - ジメチル - 2 - [(2 又は 3 -) フリル] エチル、2 - メチル - 3 - [(2 又は 3 -) フリル] プロピル等のアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフリルアルキル基を例示できる。

30

【 0 2 6 3 】

チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニル低級アルキル基としては、例えば、(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニルメチル、2 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] エチル、1 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] エチル、3 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピル、4 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] ブチル、5 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] ペンチル、6 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] ヘキシル、1 , 1 - ジメチル - 2 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] エチル、2 - メチル - 3 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピル、[2 , 4 - ジオキソ - (3 又は 5 -) チアゾリジニル] メチル、2 - [2 - オキソ - (3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] エチル、1 - [4 - オキソ - (2 , 3 又は 5 -) チアゾリジニル] エチル、3 - [2 - オキソ - (3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピル、4 - [5 - オキソ - (2 , 3 又は 4 -) チアゾリジニル] ブチル、5 - [2 , 5 - ジオキソ - (3 又は 4 -) チアゾリジニル] ペンチル、6 - [2 , 4 , 5 - トリオキソ - 3 - チアゾリジニル] ヘキシル、1 - [4 , 5 - ジオキソ - (2 又は 3 -) チアゾリジニル] エチル、2 - [4 , 5 - ジオキソ - (2 - 又

40

50

は 3 -)チアゾリジニル]エチル、1, 1 - ジメチル - 2 - [2, 4 - ジオキソ - (3 又は 5 -)チアゾリジニル]エチル、2 - メチル - 3 - [2, 4 - ジオキソ - (3 又は 5 -)チアゾリジニル]プロピル基等のチアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を 1 ~ 3 個有することがあり、アルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるチアゾリジニルアルキル基を例示できる。

【 0 2 6 4 】

チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニリデン低級アルキル基としては、例えば、(2, 4 又は 5 -)チアゾリジニリデンメチル、(2, 4 又は 5 -)チアゾリジニリデンエチル、(2, 4 又は 5 -)チアゾリジニリデンプロピル、(2, 4 又は 5 -)チアゾリジニリデンイソプロピル、(2, 4 又は 5 -)チアゾリジニリデンブチル、(2, 4 又は 5 -)チアゾリジニリデンペンチル、(2, 4 又は 5 -)チアゾリジニリデンルヘキシル、4, 5 - ジオキソ - 2 - チアゾリジニリデンメチル、2, 5 - ジオキソ - 4 - チアゾリジニリデンメチル、2, 4 - ジオキソ - 5 - チアゾリジニリデンメチル、4 - オキソ - (2 又は 5 -)チアゾリジニリデンエチル、5 - オキソ - (2 又は 4 -)チアゾリジニリデンプロピル、2 - オキソ - (4 又は 5 -)チアゾリジニリデンブチル基等のチアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を 1 ~ 3 個有することがあり、アルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるチアゾリジニリデンアルキル基を例示できる。

【 0 2 6 5 】

フェニル環上にシアノ基、置換基として低級アルキルスルホニル基を有することのあるアミノ基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニル低級アルキル基、チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるチアゾリジニリデン低級アルキル基及び低級アルキレンジオキシ基なる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよいベンゾイル基としては、例えば、ベンゾイル、4 - シアノベンゾイル、3, 4 - メチレンジオキシベンゾイル、2 - アミノベンゾイル、3 - アミノベンゾイル、4 - アミノベンゾイル、3, 4 - ジアミノベンゾイル、2, 4, 6 - トリアミノベンゾイル、4 - メトキシベンゾイル、4 - トリフルオロメチルベンゾイル、4 - クロロベンゾイル、3, 4 - ジフルオロベンゾイル、2 - フルオロベンゾイル、3 - プロモベンゾイル、4 - ヨードベンゾイル、3, 4 - ジメトキシベンゾイル、4 - フルオロベンゾイル、3 - シアノベンゾイル、2 - シアノベンゾイル、2, 3 - ジシアノベンゾイル、3, 4, 5 - トリシアノベンゾイル、4 - メチルベンゾイル、4 - (2, 4 - ジオキソチアゾリジニルメチル) ベンゾイル、4 - (2, 4 - ジオキソチアゾリジニリデンメチル) ベンゾイル、2 - メチルベンゾイル、3 - メチルベンゾイル、2 - エチルベンゾイル、3 - エチルベンゾイル、4 - エチルベンゾイル、4 - イソプロピルベンゾイル、3 - ブチルベンゾイル、4 - ペンチルベンゾイル、4 - ヘキシルベンゾイル、3, 4 - ジメチルベンゾイル、3, 4 - ジエチルベンゾイル、2, 4 - ジメチルベンゾイル、2, 5 - ジメチルベンゾイル、2, 6 - ジメチルベンゾイル、3, 4, 5 - トリメチルベンゾイル、2 - メトキシベンゾイル、3 - メトキシベンゾイル、2 - エトキシベンゾイル、3 - エトキシベンゾイル、4 - エトキシベンゾイル、4 - イソプロポキシベンゾイル、3 - ブトキシベンゾイル、4 - ペンチルオキシベンゾイル、4 - ヘキシルオキシベンゾイル、3, 4 - ジエトキシベンゾイル、2, 4 - ジメトキシベンゾイル、2, 5 - ジメトキシベンゾイル、2, 6 - ジメトキシベンゾイル、3, 4, 5 - トリメトキシベンゾイル、2 - トリフルオロメチルベンゾイル、3 - トリフルオロメチルベンゾイル、4 - トリフルオロメチルベンゾイル、2 - (プロモメチル) ベンゾイル、3 - (2 - クロロエチル) ベンゾイル、4 - (2, 3 - ジクロロプロピル) ベンゾイル、4 - (4 - フルオロブチル) ベンゾイル、3 - (5 - クロロペンチル) ベンゾイル、4 - (5 - プロモヘキシル) ベンゾイル、4 - (5, 6 - ジプロモヘキシル) ベンゾイル、3, 4 - ジ (トリフルオロメチル) ベンゾイル、3, 4 - ジ (4, 4, 4 - トリクロロブチル) ベンゾイル、2, 4 - ジ (3 - クロロ - 2 - メチルプロピル) ベンゾイル、2, 5 - ジ (3 - クロロプロピル) ベンゾイル、2,

10

20

30

40

50

6 - ジ (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) ベンゾイル、 3 , 4 , 5 - トリ (トリフルオロメチル) ベンゾイル、 4 - (2 , 2 , 2 - トリクロロエチル) ベンゾイル、 2 - メチル - 4 - トリフルオロメチルベンゾイル、 3 - エチル - 4 - トリクロロメチルベンゾイル、 2 - メトキシ - 4 - トリフルオロメチルベンゾイル、 3 - エチル - 4 - フルオロベンゾイル、 3 - エトキシ - 4 - トリクロロメチルベンゾイル、 2 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 4 - トリフルオロメチルベンゾイル、 3 - フルオロベンゾイル、 4 - フルオロベンゾイル、 2 - プロモベンゾイル、 4 - プロモベンゾイル、 2 - ヨードベンゾイル、 3 - ヨードベンゾイル、 2 , 3 - ジプロモベンゾイル、 2 , 4 - ジヨードベンゾイル、 2 , 5 - ジフルオロベンゾイル、 2 , 6 - ジクロロベンゾイル、 2 , 4 , 6 - トリクロロベンゾイル、 2 , 4 - ジフルオロベンゾイル、 3 , 4 - ジフルオロベンゾイル、 3 , 5 - ジフルオロベンゾイル、 2 , 6 - ジフルオロベンゾイル、 2 - クロロベンゾイル、 3 - クロロベンゾイル、 4 - クロロベンゾイル、 2 , 3 - ジクロロベンゾイル、 2 , 4 - ジクロロベンゾイル、 2 , 5 - ジクロロベンゾイル、 3 , 4 - ジクロロベンゾイル、 2 , 6 - ジクロロベンゾイル、 3 , 5 - ジクロロベンゾイル、 2 , 4 , 6 - トリフルオロベンゾイル、 2 , 4 - ジフルオロベンゾイル、 3 , 4 - ジフルオロベンゾイル、 3 , 4 - メチレンジオキシベンゾイル、 3 , 4 - トリメチレンジオキシベンゾイル、 2 , 3 - エチレンジオキシベンゾイル、 3 , 4 - トリメチレンジオキシベンゾイル、 2 , 3 - テトラメチレンジオキシベンゾイル、 2 , 3 - メチレンジオキシベンゾイル、 3 , 4 - エチレンジオキシベンゾイル、 2 - メタンスルホニルアミノベンゾイル基等のフェニル環上にシアノ基；置換基として炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基を 1 ~ 2 個有することのあるアミノ基；ハロゲン原子；炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状のアルコキシ基；置換基としてハロゲン原子を 1 ~ 3 個有することのある炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基；チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を 1 ~ 3 個有することがあり、アルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるチアゾリジニルアルキル基；チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基を 1 ~ 3 個有することがあり、アルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるチアゾリジニリデンアルキル基及び炭素数 1 ~ 4 の直鎖又は分枝鎖状アルキレンジオキシ基なる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよいベンゾイル基を例示できる。

10

20

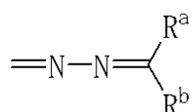
【 0 2 6 6 】

チアゾリジン環上に置換基としてオキソ基及び基

30

【 0 2 6 7 】

【 化 5 6 】



【 0 2 6 8 】

(R^a 及び R^b は、それぞれ低級アルキル基を示す。) なる群より選ばれた基が置換していてもよいチアゾリジニル低級アルカノイル基としては、例えば、 2 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] アセチル、 3 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピオニル、 2 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピオニル、 4 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] ブチリル、 5 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] ペンタノイル、 6 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] ヘキサノイル、 2 , 2 - ジメチル - 3 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピオニル、 2 - メチル - 3 - [(2 , 3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピオニル、 [2 , 4 - ジオキソ - (3 又は 5 -) チアゾリジニル] アセチル、 3 - [2 - オキソ - (3 , 4 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピオニル、 2 - [4 - オキソ - (2 , 3 又は 5 -) チアゾリジニル] プロピオニル、 4 - [5 - オキソ - (2 , 3 又は 4 -) チアゾリジニル] ブチリル、 5 - [2 , 5 - ジオキソ - (3 又は 4 -) チアゾリジニル] ペンタノイル、 6 - [2 , 4 , 5 - トリオキソ - 3 - チアゾリジニル] ヘキサノイル、 2 - [4 , 5 - ジオキソ - (2 又は 3 -) チアゾリジニル] アセチル、 2 , 2 - ジメチル - 3 - [2 , 4 - ジオキソ - (

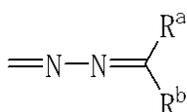
40

50

3又は5 -)チアゾリジニル]プロピオニル、2 - メチル - 3 - [2 , 4 - ジオキソ - (3又は5 -)チアゾリジニル]プロピオニル、2 - [4 - オキソ - 2 - イソプロピリデンヒドラゾノ - (3又は5 -)チアゾリジニル]アセチル、2 - [2 - オキソ - 5 - イソプロピリデンヒドラゾノ - (3又は4 -)チアゾリジニル]アセチル、2 - [2 , 4 - ジ(イソプロピリデンヒドラゾノ) - (3又は5 -)チアゾリジニル]アセチル、3 - [2 - メチリデンヒドラゾノ - (3 , 4又は5 -)チアゾリジニル]プロピオニル、2 - [4 - エチリデンヒドラゾノ - (2 , 3又は5 -)チアゾリジニル]プロピオニル、4 - [5 - プロピリデンヒドラゾノ - (2 , 3又は4 -)チアゾリジニル]ブチリル、5 - [2 , 5 - ジ(イソプロピリデンヒドラゾノ) - (3又は4 -)チアゾリジニル]ペンタノイル、6 - [2 , 4 , 5 - トリ(イソプロピリデンヒドラゾノ) - 3 - チアゾリジニル]ヘキサノイル、2 - [4 , 5 - ジ(イソプロピリデンヒドラゾノ) - (2又は3 -)チアゾリジニル]アセチル、2 , 2 - ジメチル - 3 - [4 - ブチリデンヒドラゾノ - (2 , 3又は5 -)チアゾリジニル]プロピオニル、2 - メチル - 3 - [5 - ペンチリデン - (2 , 3又は4 -)チアゾリジニル]プロピオニル、2 - (ヘキシリデンヒドラゾノ) - (3 , 4又は5 -)チアゾリジニルアセチル基等のチアゾリジン環上に置換基としてオキソ基及び基

【0269】

【化57】



【0270】

(R^a 及び R^b は、それぞれ炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を示す。) からなる群より選ばれた置換基が 1 ~ 3 個置換していてもよく、アルカノイル部分が炭素数 2 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるチアゾリジニルアルカノイル基を例示できる。

【0271】

置換基として水酸基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのある低級アルキル基としては、例えば、前記低級アルキル基に加えて、ヒドロキシメチル、2 - ヒドロキシエチル、1 - ヒドロキシエチル、3 - ヒドロキシプロピル、2 , 3 - ジヒドロキシプロピル、4 - ヒドロキシブチル、1 , 1 - ジメチル - 2 - ヒドロキシエチル、5 , 5 , 4 - トリヒドロキシペンチル、5 - ヒドロキシペンチル、6 - ヒドロキシヘキシル、1 - ヒドロキシイソプロピル、2 - メチル - 3 - ヒドロキシプロピル、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロメチル、プロモメチル、フルオロメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、ジプロモメチル、2 - クロロエチル、2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル、2 , 2 , 2 - トリクロロエチル、3 - クロロプロピル、2 , 3 - ジクロロプロピル、4 , 4 , 4 - トリクロロブチル、4 - フルオロブチル、5 - クロロペンチル、3 - クロロ - 2 - メチルプロピル、5 - プロモヘキシル、5 , 6 - ジプロモヘキシル、2 - ヒドロキシ - 3 - フルオロプロピル、2 , 2 - ジクロロ - 3 - ヒドロキシブチル基等の置換基として水酸基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を 1 ~ 3 個有することのある炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

低級アルコキシ低級アルキル基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるカルバモイル基としては、例えば、カルバモイル、N - (2 - メトキシエチル) カルバモイル、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル、プロピルカルバモイル、イソプロピルカルバモイル、ブチルカルバモイル、tert - ブチルカルバモイル、ペンチルカルバモイル、ヘキシルカルバモイル、ジメチルカルバモイル、ジエチルカルバモイル、ジプロピルカルバモイル、ジブチルカルバモイル、ジペンチルカルバモイル、ジヘキシルカルバモイル、N - メチル - N - エチルカルバモイル、N - エチル - N - プロピルカルバモイル、N - メチル - N - ブチルカルバモイル、N - メチル - N - ヘキシルカルバモイル、N - (メトキシメチル)カルバモイル、N - (3 - プロボキシプロピル) カルバモイル、N - (4 - ブトキシブチル) カルバモイル、N - (4 - エトキシイブチル) カルバモイル

10

20

30

40

50

、N - (5 - ペンチルオキシペンチル) カルバモイル、N - (5 - メトキシペンチル) カルバモイル、N - (6 - ヘキシルオキシヘキシル) カルバモイル、ジ (2 - メトキシエチル) カルバモイル、N - (2 - メトキシエチル) - N - メチルカルバモイル、N - (2 - メトキシエチル) - N - エチルカルバモイル基等の炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を有する炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群から選ばれた基を 1 ~ 2 個有することのあるカルバモイル基を例示できる。

【 0 2 7 2 】

フェニル環上に低級アルコキシ低級アルキル基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるカルバモイル基、低級アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、シアノ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル低級アルキル基及び水酸基なる群から選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよいフェニル基としては、例えば、フェニル、2 - メチルフェニル、3 - メチルフェニル、4 - メチルフェニル、2 - エチルフェニル、3 - エチルフェニル、4 - エチルフェニル、4 - イソプロピルフェニル、3 - ブチルフェニル、4 - ペンチルフェニル、4 - ヘキシルフェニル、3, 4 - ジメチルフェニル、3, 4 - ジエチルフェニル、2, 4 - ジメチルフェニル、2, 3 - ジメチルフェニル、2, 5 - ジメチルフェニル、2, 6 - ジメチルフェニル、3, 4, 5 - トリメチルフェニル、2 - メトキシフェニル、3 - メトキシフェニル、4 - メトキシフェニル、2 - エトキシフェニル、3 - エトキシフェニル、4 - エトキシフェニル、4 - イソプロポキシフェニル、3 - ブトキシフェニル、4 - ペンチルオキシフェニル、4 - ヘキシルオキシフェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、3, 4 - ジエトキシフェニル、2, 4 - ジメトキシフェニル、2, 5 - ジメトキシフェニル、2, 6 - ジメトキシフェニル、3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、2 - トリフルオロメトキシフェニル、3 - トリフルオロメトキシフェニル、4 - トリフルオロメトキシフェニル、2 - (プロモメトキシ) フェニル、3 - (2 - クロロエトキシ) フェニル、4 - (2, 3 - ジクロロプロポキシ) フェニル、4 - (4 - フルオロプロトキシ) フェニル、3 - (5 - クロロペンチルオキシ) フェニル、4 - (5 - プロモヘキシルオキシ) フェニル、4 - (5, 6 - ジプロモヘキシルオキシ) フェニル、3, 4 - ジ (トリフルオロメトキシ) フェニル、3, 4 - ジ (4, 4, 4 - トリクロロプロトキシ) フェニル、2, 4 - ジ (3 - クロロ - 2 - メトキシプロピル) フェニル、2, 5 - ジ (3 - クロロプロポキシ) フェニル、2, 6 - ジ (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) フェニル、3, 4, 5 - トリ (トリフルオロメトキシ) フェニル、4 - (2, 2, 2 - トリクロロエトキシ) フェニル、2 - メチル - 4 - トリフルオロメトキシフェニル、3 - エチル - 4 - トリクロロメトキシフェニル、2 - メトキシ - 4 - トリフルオロメトキシフェニル、3 - エトキシ - 4 - トリクロロメトキシフェニル、2 - トリフルオロメチルフェニル、3 - トリフルオロメチルフェニル、4 - トリフルオロメチルフェニル、2 - (プロモメチル) フェニル、3 - (2 - クロロエチル) フェニル、4 - (2, 3 - ジクロロプロピル) フェニル、4 - (4 - フルオロブチル) フェニル、3 - (5 - クロロペンチル) フェニル、4 - (5 - プロモヘキシル) フェニル、4 - (5, 6 - ジプロモヘキシル) フェニル、3, 4 - ジ (トリフルオロメチル) フェニル、3, 4 - ジ (4, 4, 4 - トリクロロブチル) フェニル、2, 4 - ジ (3 - クロロ - 2 - メチルプロピル) フェニル、2, 5 - ジ (3 - クロロプロピル) フェニル、2, 6 - ジ (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) フェニル、3, 4, 5 - トリ (トリフルオロメチル) フェニル、4 - (2, 2, 2 - トリクロロエチル) フェニル、2 - メチル - 4 - トリフルオロメチルフェニル、3 - エチル - 4 - トリクロロメチルフェニル、2 - メトキシカルボニルフェニル、3 - メトキシカルボニルフェニル、4 - メトキシカルボニルフェニル、2 - エトキシカルボニルフェニル、3 - エトキシカルボニルフェニル、4 - エトキシカルボニルフェニル、4 - イソプロポキシカルボニルフェニル、3 - ブトキシカルボニルフェニル、4 - t e r t - ブトキシカルボニルフェ

10

20

30

40

50

ニル、4 - ペンチルオキシカルボニルフェニル、4 - ヘキシルオキシカルボニルフェニル、3, 4 - ジメトキシカルボニルフェニル、3, 4 - ジエトキシカルボニルフェニル、2, 4 - ジメトキシカルボニルフェニル、2, 5 - ジエトキシカルボニルフェニル、2, 6 - ジメトキシカルボニルフェニル、3, 4, 5 - トリエトキシカルボニルフェニル、2 - シアノフェニル、3 - シアノフェニル、4 - シアノフェニル、3, 4 - ジシアノフェニル、3, 5 - ジシアノフェニル、2, 4 - ジシアノフェニル、2, 5 - ジシアノフェニル、2, 6 - ジシアノフェニル、3, 4, 5 - トリシアノフェニル、2 - フェニルフェニル、3 - フェニルフェニル、4 - フェニルフェニル、3, 4 - ジフェニルフェニル、3, 5 - ジフェニルフェニル、2, 4 - ジフェニルフェニル、2, 5 - ジフェニルフェニル、2, 6 - ジフェニルフェニル、3, 4, 5 - トリフェニルフェニル、2 - クロロフェニル、3 - クロロフェニル、4 - クロロフェニル、2, 3 - ジクロロフェニル、2, 4 - ジクロロフェニル、2, 5 - ジクロロフェニル、3, 4 - ジクロロフェニル、2, 6 - ジクロロフェニル、3, 5 - ジクロロフェニル、2, 4, 6 - トリクロロフェニル、2 - フルオロフェニル、3 - フルオロフェニル、4 - フルオロフェニル、2, 5 - ジフルオロフェニル、2, 4 - ジフルオロフェニル、3, 4 - ジフルオロフェニル、3, 5 - ジフルオロフェニル、2, 6 - ジフルオロフェニル、2, 4, 6 - トリフルオロフェニル、2 - プロモフェニル、3 - プロモフェニル、4 - プロモフェニル、2 - ヨードフェニル、3 - ヨードフェニル、4 - ヨードフェニル、2, 3 - ジプロモフェニル、2, 4 - ジヨードフェニル、2 - ヒドロキシフェニル、3 - ヒドロキシフェニル、4 - ヒドロキシフェニル、3, 4 - ジヒドロキシフェニル、3, 5 - ジヒドロキシフェニル、2, 4 - ジヒドロキシフェニル、2, 5 - ジヒドロキシフェニル、2, 6 - ジヒドロキシフェニル、3, 4, 5 - トリヒドロキシフェニル、3 - ベンジルフェニル、2 - (2 - フェニルエチル)フェニル、4 - (1 - フェニルエチル)フェニル、2 - (3 - フェニルプロピル)フェニル、3 - (4 - フェニルブチル)フェニル、4 - (5 - フェニルペンチル)フェニル、2 - (6 - フェニルヘキシル)フェニル、4 - (1, 1 - ジメチル - 2 - フェニルエチル)フェニル、3 - (2 - メチル - 3 - フェニルプロピル)フェニル、2 - (4 - フルオロベンジル)フェニル、2 - メチル - 5 - クロロフェニル、2 - メトキシ - 5 - クロロフェニル、4 - (4 - フルオロベンゾイル)フェニル、4 - (4 - フルオロベンジル)フェニル、3 - (2 - クロロベンジル)フェニル、4 - (3 - クロロベンジル)フェニル、2 - (4 - クロロベンジル)フェニル、3 - [2 - (4 - フルオロフェニル)エチル]フェニル、4 - [2 - (4 - クロロフェニル)エチル]フェニル、2 - (3, 4 - ジプロモベンジル)フェニル、3 - (3, 4 - ジヨードベンジル)フェニル、4 - (2, 4 - ジフルオロベンジル)フェニル、2 - (2, 5 - ジクロロベンジル)フェニル、3 - (2, 6 - ジクロロベンジル)フェニル、4 - (3, 4, 5 - トリフルオロベンジル)フェニル、2 - [3 - (4 - クロロフェニル)プロピル]フェニル、3 - [1 - (2 - プロモフェニル)エチル]フェニル、4 - [4 - (3 - フルオロフェニル)ブチル]フェニル、2 - [5 - (4 - ヨードフェニル)ペンチル]フェニル、3 - [6 - (4 - クロロフェニル)ヘキシル]フェニル、2 - [1, 1 - ジメチル - 2 - (3 - フルオロフェニル)エチル]フェニル、4 - [2 - メチル - 3 - (4 - クロロフェニル)プロピル]フェニル、2, 4 - ジベンジルフェニル、2, 4, 6 - トリベンジルフェニル、2 - クロロ - 4 - シアノフェニル、3 - ヒドロキシ - 4 - フェニルフェニル、3 - エトキシカルボニル - 2 - ベンゾイルフェニル、2 - ベンジル - 4 - メチル - 6 - メトキシフェニル、4 - [(2 - メトキシエチル)カルバモイル]フェニル、3 - (N - エチル - N - イソプロピルカルバモイル)フェニル、4 - ジメチルカルバモイルフェニル、2 - カルボキシフェニル、3 - カルボキシフェニル、4 - カルボキシフェニル基等のフェニル環上にアルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるアルコキシアルキル基及び炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群から選ばれた基を1~2個有することのあるカルバモイル基；炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基；カルボキシ基；シアノ基；フェニル基；ハロゲン原子；置換基としてハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基；

10

20

30

40

50

置換基としてハロゲン原子を1～3個有することのある炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子1～3個を有することのあるベンゾイル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1～3個有することがあり、アルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基及び水酸基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよいフェニル基を例示できる。

【0273】

フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有するフェニル基としては、例えば、3,4-メチレンジオキシフェニル、3,4-トリメチレンジオキシフェニル、2,3-エチレンジオキシフェニル、2,3-テトラメチレンジオキシフェニル、2,3-メチレンジオキシフェニル、3,4-エチレンジオキシフェニル、2,3-トリメチレンジオキシフェニル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖状アルキレンジオキシ基を有するフェニル基を例示できる。

10

【0274】

ナフチル低級アルキル基としては、例えば、(1又は2-)ナフチルメチル、2-[(1又は2-)ナフチル]エチル、1-[(1又は2-)ナフチル]エチル、3-[(1又は2-)ナフチル]プロピル、4-[(1又は2-)ナフチル]ブチル、5-[(1又は2-)ナフチル]ペンチル、6-[(1又は2-)ナフチル]ヘキシル、1,1-ジメチル-2-[(1又は2-)ナフチル]エチル、2-メチル-3-[(1又は2-)ナフチル]プロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるナフチルアルキル基を例示できる。

20

【0275】

フェニル環上にシアノ基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基なる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよいフェノキシ基としては、例えば、フェノキシ、2-メチルフェノキシ、3-メチルフェニル、4-メチルフェノキシ、2-エチルフェノキシ、3-エチルフェノキシ、4-エチルフェノキシ、4-イソプロピルフェノキシ、3-ブチルフェノキシ、4-ペンチルフェノキシ、4-ヘキシルフェノキシ、3,4-ジメチルフェノキシ、3,4-ジエチルフェノキシ、2,4-ジメチルフェノキシ、2,5-ジメチルフェノキシ、2,6-ジメチルフェノキシ、3,4,5-トリメチルフェノキシ、2-メトキシフェノキシ、3-メトキシフェノキシ、4-メトキシフェノキシ、2-エトキシフェノキシ、3-エトキシフェノキシ、4-エトキシフェノキシ、4-イソプロポキシフェノキシ、3-ブトキシフェノキシ、4-ペンチルオキシフェノキシ、4-ヘキシルオキシフェノキシ、3,4-ジメトキシフェノキシ、3,4-ジエトキシフェノキシ、2,4-ジメトキシフェノキシ、2,5-ジメトキシフェノキシ、2,6-ジメトキシフェノキシ、3,4,5-トリメトキシフェノキシ、2-トリフルオロメトキシフェノキシ、3-トリフルオロメトキシフェノキシ、4-トリフルオロメトキシフェノキシ、2-(プロモメトキシ)フェノキシ、3-(2-クロロエトキシ)フェノキシ、4-(2,3-ジクロロプロポキシ)フェノキシ、4-(4-フルオロブトキシ)フェノキシ、3-(5-クロロペンチルオキシ)フェノキシ、4-(5-プロモヘキシルオキシ)フェノキシ、4-(5,6-ジプロモヘキシルオキシ)フェノキシ、3,4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ、3,4-ジ(4,4,4-トリクロロブトキシ)フェノキシ、2,4-ジ(3-クロロ-2-メトキシプロピル)フェノキシ、2,5-ジ(3-クロロプロポキシ)フェノキシ、2,6-ジ(2,2,2-トリフルオロエトキシ)フェノキシ、3,4,5-トリ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ、4-(2,2,2-トリクロロエトキシ)フェノキシ、2-メチル-4-トリフルオロメトキシフェノキシ、3-エチル-4-トリクロロメトキシフェノキシ、2-メトキシ-4-トリフルオロメトキシフェノキシ、3-エトキシ-4-トリクロロメトキシフェノキシ、2-トリフルオロメチルフェノキシ、3-トリフルオロメチルフェノキシ、4-トリフルオロメチルフェノキシ、2-(プロモメチル)フェノキシ、3-(2-クロロエチル)フェノキシ、4-(2,3-ジクロロプロピル)フェノキシ、4-(4-フルオロブチル)フェノキシ、3-(5-クロロペンチル)

30

40

50

フェノキシ、4 - (5 - プロモヘキシル)フェノキシ、4 - (5, 6 - ジプロモヘキシル)フェノキシ、3, 4 - ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ、3, 4 - ジ(4, 4, 4 - トリクロロブチル)フェノキシ、2, 4 - ジ(3 - クロロ - 2 - メチルプロピル)フェノキシ、2, 5 - ジ(3 - クロロプロピル)フェノキシ、2, 6 - ジ(2, 2, 2 - トリフルオロエチル)フェノキシ、3, 4, 5 - トリ(トリフルオロメチル)フェノキシ、4 - (2, 2, 2 - トリクロロエチル)フェノキシ、2 - メチル - 4 - トリフルオロメチルフェノキシ、3 - エチル - 4 - トリクロロメチルフェノキシ、2 - シアノフェノキシ、3 - シアノフェノキシ、4 - シアノフェノキシ、3, 4 - ジシアノフェノキシ、3, 5 - ジシアノフェノキシ、2, 3 - ジシアノフェノキシ、2, 4 - ジシアノフェノキシ、2, 5 - ジシアノフェノキシ、2, 6 - ジシアノフェノキシ、3, 4, 5 - トリシアノフェノキシ、2 - シアノ - 4 - メチルフェノキシ、3 - シアノ - 4 - メトキシフェノキシ、3 - シアノ - 5 - トリフルオロメチルフェノキシ、4 - シアノ - 3 - トリフルオロメトキシフェノキシ基等のフェニル環上にシアノ基、置換基としてハロゲン原子を1 ~ 3個有することのある炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び置換基としてハロゲン原子1 ~ 3個を有することのある炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基なる群より選ばれた基が1 ~ 3個置換していてもよいフェノキシ基を例示できる。

【0276】

フェニル環上にハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基なる群から選ばれた基が1 ~ 3個置換していてもよいフェニル低級アルコキシ基としては、例えば、前記フェニル低級アルコキシ基に加えて、2, 5 - ジフルオロベンジルオキシ、2, 4 - ジフルオロベンジルオキシ、3, 4 - ジフルオロベンジルオキシ、3, 5 - ジフルオロベンジルオキシ、2, 6 - ジフルオロベンジルオキシ、3 - トリフルオロメチルベンジルオキシ、2 - トリフルオロメチルベンジルオキシ、4 - トリフルオロメチルベンジルオキシ、3, 4 - ジメトキシベンジルオキシ、3, 5 - ジメトキシベンジルオキシ、2 - クロロベンジルオキシ、3 - クロロベンジルオキシ、4 - クロロベンジルオキシ、2 - メチルベンジルオキシ、3 - メチルベンジルオキシ、4 - メチルベンジルオキシ、3, 4 - ジメチルベンジルオキシ、2, 3 - ジメチルベンジルオキシ、2 - メトキシベンジルオキシ、3 - メトキシベンジルオキシ、4 - メトキシベンジルオキシ、2, 3 - ジクロロベンジルオキシ、2, 4 - ジクロロベンジルオキシ、2, 5 - ジクロロベンジルオキシ、3, 4 - ジクロロベンジルオキシ、2, 6 - ジクロロベンジルオキシ、4 - フルオロベンジルオキシ、3 - フルオロベンジルオキシ、2 - フルオロベンジルオキシ、3 - トリフルオロメトキシベンジルオキシ、4 - トリフルオロメトキシベンジルオキシ、2 - トリフルオロメトキシベンジルオキシ、4 - tert - ブチルベンジルオキシ、4 - エチルベンジルオキシ、4 - イソプロピルベンジルオキシ、4 - メトキシ - 3 - クロロベンジルオキシ、2 - (4 - メトキシフェニル)エトキシ、2 - (4 - フルオロフェニル)エトキシ、2 - (4 - クロロフェニル)エトキシ、2 - (3 - メトキシフェニル)エトキシ、2 - (4 - メチルフェニル)エトキシ、3 - メチル - 4 - クロロベンジルオキシ、4 - (4 - メトキシフェニル)プトキシ、2 - (4 - メチルフェニル)エトキシ、4 - tert - ブトキシベンジルオキシ、3 - クロロ - 6 - メトキシベンジルオキシ、4 - メトキシ - 3 - メチルベンジルオキシ、2 - (2 - フルオロフェニル)エトキシ、1 - (3 - プロモフェニル)エトキシ、3 - (4 - ヨードフェニル)プロポキシ、4 - (2 - プロモフェニル)プトキシ、5 - (3 - クロロフェニル)ペンチルオキシ、6 - (4 - プロモフェニル)ヘキシルオキシ、1, 1 - ジメチル - 2 - (2, 4 - ジクロロフェニル)エトキシ、2 - メチル - 3 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル)プロポキシ、2 - (2 - エチルフェニル)エトキシ、1 - (3 - プロピルフェニル)エトキシ、3 - (4 - ブチルフェニル)プロポキシ、4 - (2 - ペンチルフェニル)プトキシ、5 - (3 - ヘキシルフェニル)ペンチルオキシ、6 - (4 - トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシ、1, 1 - ジメチル - 2 - (2, 4 - ジメチルフェニル)エトキシ、2 - メチル - 3 - [2, 4, 6 - トリ(トリフルオロメチル)フェニル]プロポキシ、2 - (2 - エトキシフェニル)エトキシ、1 - (3 - プロ

10

20

30

40

50

ポキシフェニル)エトキシ、3-(4-プトキシフェニル)プロポキシ、4-(2-ペンチルオキシフェニル)プトキシ、5-(3-ヘキシルオキシフェニル)ペンチルオキシ、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシ、1,1-ジメチル-2-(2,4-ジメトキシフェニル)エトキシ、2-メチル-3-[2,4,6-トリ(トリフルオロメトキシ)フェニル]プロポキシ等のフェニル環上にハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子1~3個を有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及び置換基としてハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基なる群から選ばれた基が1~3個置換していてもよく、アルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるフェニルアルコキシ基を例示できる。

10

【0277】

1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン環上に置換基として低級アルキル基を1~5個有していてもよい1,2,3,4-テトラヒドロナフチル置換低級アルキル基としては、例えば、(1,2,5又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチルメチル、2-[(1,2,5又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]エチル、1-[(1,2,5又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]エチル、3-[(1,2,5又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]プロピル、4-[(1,2,5又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]ブチル、5-[(1,2,5又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]ペンチル、6-[(1,2,5又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]ヘキシル、1,1-ジメチル-2-[(1,2,5又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]エチル、2-メチル-3-[(1,2,5又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]プロピル、1,1,4,4-テトラメチル(2,3,5又は6-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチルメチル、1,1,4,4,5-ペンタメチル(2,3,6,7又は8-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチルメチル、1,4,4-トリメチル(2,3,5,6,7又は8-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチルメチル、5,6-ジメチル(2,3,7又は8-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチルメチル、2-[1-メチル-(1,2,3,4,5,6,7又は8-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]エチル、1-[2-エチル-(1,2,3,4,5,6,7又は8-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]エチル、3-[3-プロピル-(1,2,3,4,5,6,7又は8-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]プロピル、4-[(4-ブチル-1,2,3,4,5,6,7又は8-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]ブチル、5-[5-ペンチル-(1,2,3,4,6,7又は8-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]ペンチル、6-[6-ヘキシル-(1,2,3,4,5,7又は8-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]ヘキシル、1,1-ジメチル-2-[1,7-ジメチル-(1,2,3,4,5,6又は8-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]エチル、2-メチル-3-[1,1,4-トリメチル-(2,3,4,5,6,7又は8-)1,2,3,4-テトラヒドロナフチル]プロピル基等の1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~5個有していてもよく、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である1,2,3,4-テトラヒドロナフチル置換アルキル基を例示できる。

20

30

40

【0278】

ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を1~3個有していてもよいピペリジニル基としては、例えば、(1,2,3又は4-)ピペリジニル、1-メチル-(2,3又は4-)ピペリジニル、1-エチル-(2,3又は4-)ピペリジニル、1-プロピル-(2,3又は4-)ピペリジニル、1-イソプロピル-(2,3又は4-)ピペリジニル、1-ブチル-(2,3又は4-)ピペリジニル、1-イソブチル-(2,3又は4-)ピペリジニル、1-tert-ブチル-(2,3又は4-)ピペリジニル、1-ペンチル-(2,3又は4-)ピペリジニル、1-ヘキシル-(2,3又は4-)ピペリジニル、1,2-ジメチル-(3,4,5又は6-)ピペリジニル、1,2,6-トリメチル-(

50

3, 4又は5 -)ピペリジニル基等のピペリジン環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~3個有していてもよいピペリジニル基を例示できる。

【0279】

キノリル低級アルキル基としては、例えば、(2, 3, 4, 5, 6, 7又は8 -)キノリルメチル、2 - [(2, 3, 4, 5, 6, 7又は8 -)キノリル]エチル、1 - [(2, 3, 4, 5, 6, 7又は8 -)キノリル]エチル、3 - [(2, 3, 4, 5, 6, 7又は8 -)キノリル]プロピル、4 - [(2, 3, 4, 5, 6, 7又は8 -)キノリル]ブチル、5 - [(2, 3, 4, 5, 6, 7又は8 -)キノリル]ペンチル、6 - [(2, 3, 4, 5, 6, 7又は8 -)キノリル]ヘキシル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるキノリルアルキル基を挙げることができる。

10

【0280】

テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのある1, 2, 3, 4 - テトラゾリル低級アルキル基としては、例えば、[(1又は5 -)1, 2, 3, 4 - テトラゾリル]メチル、2 - [(1又は5 -)1, 2, 3, 4 - テトラゾリル]エチル、1 - [(1又は5 -)1, 2, 3, 4 - テトラゾリル]エチル、3 - [(1又は5 -)1, 2, 3, 4 - テトラゾリル]プロピル、4 - [(1又は5 -)1, 2, 3, 4 - テトラゾリル]ブチル、5 - [(1又は5 -)1, 2, 3, 4 - テトラゾリル]ペンチル、6 - [(1又は5 -)1, 2, 3, 4 - テトラゾリル]ヘキシル、5 - [1 - メチル - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]ペンチル、6 - [1 - メチル - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]ヘキシル、5 - メチル - 1 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)メチル、2 - [5 - エチル - 1 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [(1又は5 -)1, 2, 3, 4 - テトラゾリル]エチル、2 - メチル - 3 - [(1又は5 -)1, 2, 3, 4 - テトラゾリル]プロピル、[1 - メチル - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]メチル、[1 - エチル - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]メチル、2 - [1 - プロピル - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]エチル、1 - [1 - ブチル - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]エチル、3 - [1 - ペンチル - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]プロピル、3 - [5 - プロピル - 1 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]プロピル、4 - [5 - ブチル - 1 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]ブチル、5 - [5 - ペンチル - 1 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]ペンチル、6 - [5 - ヘキシル - 1 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]ヘキシル、[1 - エチル - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]メチル、[1 - ベンジル - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]メチル、1 - [(2 - フェニルエチル) - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]メチル、2 - [1 - (3 - フェニルプロピル) - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]エチル、1 - [1 - (4 - フェニルブチル) - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]エチル、3 - [1 - (5 - フェニルペンチル) - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]プロピル、4 - [1 - (6 - フェニルヘキシル) - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]ブチル、5 - [1 - (1, 1 - ジメチル - 2 - フェニルエチル) - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]メチル、6 - [1 - (2 - メチル - 3 - フェニルプロピル) - 5 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]ヘキシル、5 - ベンジル - 1 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)メチル、2 - [5 - (1 - フェニルエチル) - 1 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]エチル、3 - [5 - (3 - フェニルプロピル) - 1 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]プロピル、4 - [5 - (4 - フェニルブチル) - 1 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]ブチル、5 - [5 - (5 - フェニルペンチル) - 1 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]ペンチル、6 - [5 - (6 - フェニルヘキシル) - 1 - (1, 2, 3, 4 - テトラゾリル)]ヘキシル基等のテトラゾール環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基なる群から選ばれた基を有することがあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である1, 2, 3, 4 - テトラゾリルアルキル基を例示できる。

20

30

40

50

【0281】

チアゾール環上に置換基としてフェニル基を有することのあるチアゾリル低級アルキル基としては、例えば、[(2, 4又は5-)チアゾリル]メチル、2-[(2, 4又は5-)チアゾリル]エチル、1-[(2, 4又は5-)チアゾリル]エチル、3-[(2, 4又は5-)チアゾリル]プロピル、4-[(2, 4又は5-)チアゾリル]ブチル、5-[(2, 4又は5-)チアゾリル]ペンチル、6-[(2, 4又は5-)チアゾリル]ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-[(2, 4又は5-)チアゾリル]エチル、2-メチル-3-[(2, 4又は5-)チアゾリル]プロピル、[2-フェニル-(4又は5-)チアゾリル]メチル、2-[4-フェニル-(2又は5-)チアゾリル]エチル、1-[5-フェニル-(2又は4-)チアゾリル]エチル、3-[2-フェニル-(2又は5-)チアゾリル]プロピル、4-(2, 4-ジフェニル-5-チアゾリル)ブチル、5-(2, 5-ジフェニル-4-チアゾリル)ペンチル、6-(4, 5-ジフェニル-2-チアゾリル)ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-[2-フェニル-(4又は5-)チアゾリル]エチル、2-メチル-3-[4-フェニル-(2又は5-)チアゾリル]プロピル、[4-フェニル-(2又は5-)チアゾリル]メチル、[5-フェニル-(2又は4-)チアゾリル]メチル、(2, 4-ジフェニル-5-チアゾリル)メチル、(2, 5-ジフェニル-4-チアゾリル)メチル、(4, 5-ジフェニル-2-チアゾリル)メチル基等のチアゾール環上に置換基としてフェニル基を1~2個有することがあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるチアゾリルアルキル基を例示できる。

10

【0282】

フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基及びハロゲン原子なる群から選ばれる基を1~3個有することのあるベンゾイル低級アルキル基としては、例えば、ベンゾイルメチル、2-ベンゾイルエチル、1-ベンゾイルエチル、3-ベンゾイルプロピル、4-ベンゾイルブチル、5-ベンゾイルペンチル、6-ベンゾイルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-ベンゾイルエチル、2-メチル-3-ベンゾイルプロピル、4-フルオロベンゾイルメチル、2-クロロベンゾイルメチル、3-クロロベンゾイルメチル、4-クロロベンゾイルメチル、2-(4-フルオロベンゾイル)エチル、2-(4-クロロベンゾイル)エチル、3, 4-ジプロモベンゾイルメチル、3, 4-ジヨードベンゾイルメチル、2, 4-ジフルオロベンゾイルメチル、2, 5-ジクロロベンゾイルメチル、2, 6-ジクロロベンゾイルメチル、3, 4, 5-トリフルオロベンゾイルメチル、3-(4-クロロベンゾイル)プロピル、1-(2-プロモベンゾイル)エチル、4-(3-フルオロベンゾイル)ブチル、5-(4-ヨードベンゾイル)ペンチル、6-(4-クロロベンゾイル)ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-(3-フルオロベンゾイル)エチル、2-メチル-3-(4-クロロベンゾイル)プロピル、2-メトキシベンゾイルメチル、2-(3-メトキシベンゾイル)エチル、2-(4-メトキシベンゾイル)エチル、4-メトキシベンゾイルメチル、1-(2-エトキシベンゾイル)エチル、3-(3-エトキシベンゾイル)プロピル、4-(4-エトキシベンゾイル)ブチル、5-(4-イソプロポキシベンゾイル)ペンチル、6-(3-ブトキシベンゾイル)ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-(4-ペンチルオキシベンゾイル)エチル、2-メチル-3-(4-ヘキシルオキシベンゾイル)プロピル、3, 4-ジメトキシベンゾイルメチル、3, 4-ジエトキシベンゾイルメチル、2, 4-ジメトキシベンゾイルメチル、2, 5-ジメトキシベンゾイルメチル、2, 6-ジメトキシベンゾイルメチル、3, 4, 5-トリメトキシベンゾイルメチル、2-クロロ-4-メトキシベンゾイルメチル、3-フルオロ-5-エトキシベンゾイルメチル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基及びハロゲン原子なる群から選ばれる基を1~3個有することがあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるベンゾイルアルキル基を例示できる。

20

30

40

【0283】

ピペリジン環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるピペリジニル低級アルキル基としては、例えば、[(1, 2, 3又は4-)ピペリジニル]メチル、2-[(1, 2, 3又は4-)ピペリジニル]エチル、1-[(1, 2, 3又は4-)ピペリジニ

50

ル]エチル、3 - [(1, 2, 3又は4 -)ピペリジニル]プロピル、4 - [(1, 2, 3又は4 -)ピペリジニル]ブチル、5 - [(1, 2, 3又は4 -)ピペリジニル]ペンチル、6 - [(1, 2, 3又は4 -)ピペリジニル]ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [(1, 2, 3又は4 -)ピペリジニル]エチル、2 - メチル - 3 - [(1, 2, 3又は4 -)ピペリジニル]プロピル、[1 - メチル - (2, 3又は4 -)ピペリジニル]メチル、2 - [1 - エチル - (2, 3又は4 -)ピペリジニル]エチル、1 - [4 - プロピル - (1, 2又は3 -)ピペリジニル]エチル、3 - [3 - イソプロピル - (1, 2, 4, 5又は6 -)ピペリジニル]プロピル、4 - [2 - ブチル - (1, 3, 4, 5又は6 -)ピペリジニル]ブチル、5 - [1 - イソブチル - (2, 3又は4 -)ピペリジニル]ペンチル、6 - [1 - tert - ブチル - (2, 3又は4 -)ピペリジニル]ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [4 - ペンチル - (1, 2又は3 -)ピペリジニル]エチル、2 - メチル - 3 - [1 - ヘキシル - (2, 3又は4 -)ピペリジニル]プロピル、[1, 2 - ジメチル - (3, 4, 5又は6 -)ピペリジニル]メチル、[1, 2, 6 - トリメチル - (3, 4又は5 -)ピペリジニル]メチル基等のピペリジン環上に置換基として炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1 ~ 3個有することがあり、アルキル部分が炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピペリジニルアルキル基を例示できる。

【0284】

イミダゾール環上に置換基としてフェニル基を1 ~ 3個有することのあるイミダゾリル基としては、例えば、(1, 2, 4又は5 -)イミダゾリル、1 - フェニル - (2, 4又は5 -)イミダゾリル、2 - フェニル - (1, 4又は5 -)イミダゾリル、4 - フェニル - (1, 2又は5 -)イミダゾリル、5 - フェニル - (1, 2又は4 -)イミダゾリル、1, 2 - ジフェニル - (4又は5 -)イミダゾリル、2, 4 - ジフェニル - (1又は5 -)イミダゾリル、4, 5 - ジフェニル - (1又は2 -)イミダゾリル、2, 5 - ジフェニル - (1又は4 -)イミダゾリル、2, 4, 5 - トリフェニル - 1 - イミダゾリル基等のイミダゾール環上に置換基としてフェニル基を1 ~ 3個有することのあるイミダゾリル基を例示できる。

【0285】

ベンズイミダゾール環上に置換基として低級アルキル基を1 ~ 3個有することのあるベンズイミダゾリル基としては、例えば、(1, 2, 4, 5, 6又は7 -)ベンズイミダゾリル、1 - メチル - (2, 4, 5, 6又は7 -)ベンズイミダゾリル、2 - エチル - (1, 4, 5, 6又は7 -)ベンズイミダゾリル、4 - プロピル - (1, 2, 5, 6又は7 -)ベンズイミダゾリル、5 - ブチル - (1, 2, 4, 6又は7 -)ベンズイミダゾリル、6 - ペンチル - (1, 2, 4, 5又は7 -)ベンズイミダゾリル、7 - ヘキシル - (1, 2, 4, 5又は6 -)ベンズイミダゾリル、1 - エチル - (2, 4, 5, 6又は7 -)ベンズイミダゾリル]ヘキシル、1 - ブチル - (2, 4, 5, 6又は7 -)ベンズイミダゾリル、1 - イソプロピル - (1, 2, 4, 5, 6又は7 -)ベンズイミダゾリル、1, 2 - ジメチル - (4, 5, 6又は7 -)ベンズイミダゾリル、1 - メチル - 4 - エチル - (2, 5, 6又は7 -)ベンズイミダゾリル、1 - プロピル - 5 - メチル - (2, 4, 6又は7 -)ベンズイミダゾリル、1, 2, 5 - トリメチル - (2, 4, 5, 6又は7 -)ベンズイミダゾリル基等のベンズイミダゾール環上に置換基として炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1 ~ 3個有することのあるベンズイミダゾリル基を例示できる。

【0286】

ピリジル低級アルコキシ基としては、例えば、(2, 3又は4 -)ピリジルメトキシ、2 - [(2, 3又は4 -)ピリジル]エトキシ、1 - [(2, 3又は4 -)ピリジル]エトキシ、3 - [(2, 3又は4 -)ピリジル]プロポキシ、4 - [(2, 3又は4 -)ピリジル]ブトキシ、1, 1 - ジメチル - 2 - [(2, 3又は4 -)ピリジル]エトキシ、5 - [(2, 3又は4 -)ピリジル]ペンチルオキシ、6 - [(2, 3又は4 -)ピリジル]ヘキシルオキシ、1 - [(2, 3又は4 -)ピリジル]イソプロポキシ、2 - メチル - 3 - [(2, 3又は4 -)ピリジル]プロポキシ基等のアルキル部分が炭素数1 ~ 6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピリジルアルコキシ基を例示できる。

10

20

30

40

50

【0287】

テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキソ基を有することのある1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル低級アルキル基としては、例えば、(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリルメチル、2-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]エチル、1-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]エチル、3-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]プロピル、4-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]ブチル、5-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]ペンチル、6-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]エチル、2-メチル-3-[(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]プロピル、[2-オキソ-(1, 3, 4, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]メチル、[4-オキソ-(1, 2, 3, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]メチル、[2, 4-ジオキソ-(1, 3, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]メチル、2-[2-オキソ-(1, 3, 4, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]エチル、3-[4-オキソ-(1, 2, 3, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]プロピル、4-[2, 4-ジオキソ-(1, 3, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]ブチル、5-[2-オキソ-(1, 3, 4, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]ペンチル、6-[4-オキソ-(1, 2, 3, 5, 6, 7又は8-)1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル]ヘキシル基等のテトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキソ基1~2個を有することがあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリルアルキル基を例示できる。

10

20

【0288】

1, 3, 4-オキサジアゾール環上に置換基としてオキソ基を有することのある1, 3, 4-オキサジアゾリル低級アルキル基としては、例えば、(2又は5-)1, 3, 4-オキサジアゾリルメチル、2-[(2又は5-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]エチル、1-[(2又は5-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]エチル、3-[(2又は5-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]プロピル、4-[(2又は5-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]ブチル、5-[(2又は5-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]ペンチル、6-[(2又は5-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-[(2又は5-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]エチル、2-メチル-3-[(2又は5-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]プロピル、2-オキソ-[(3又は5-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]メチル、5-オキソ-[(2又は3-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]メチル、2-[2-オキソ-(3又は5-)(1, 3, 4-オキサジアゾリル)]エチル、1-[5-オキソ-(2又は3-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]エチル、3-[(2又は5-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]プロピル、4-[2-オキソ(3又は5-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]ブチル、5-[5-オキソ(2又は3-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]ペンチル、6-[2-オキソ(3又は5-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-[5-オキソ(2又は3-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]エチル、2-メチル-3-[2-オキソ(3又は5-)1, 3, 4-オキサジアゾリル]プロピル基等の1, 3, 4-オキサジアゾール環上に置換基としてオキソ基を有することがあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である1, 3, 4-オキサジアゾリルアルキル基を例示できる。

30

40

【0289】

チエニル低級アルキル基としては、例えば、(2又は3-)チエニルメチル、2-[(2又は3-)チエニル]エチル、1-[(2又は3-)チエニル]エチル、3-[(2又

50

は 3 -)チエニル]プロピル、4 - [(2又は3 -)チエニル]ブチル、5 - [(2又は3 -)チエニル]ペンチル、6 - [(2又は3 -)チエニル]ヘキシル、1, 1 - ジメチル - 2 - [(2又は3 -)チエニル]エチル、2 - メチル - 3 - [(2又は3 -)チエニル]プロピル基等のアルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるチエニルアルキル基を例示できる。

【0290】

ピリミジン環上に置換基としてオキソ基を有することのあるピリミジニルカルボニル基としては、例えば、(2, 3, 4又は6 -)ピリミジニルカルボニル、2, 6 - ジオキソ - (1, 3, 4又は5 -)ピリミジニルカルボニル、2 - オキソ - (1, 3, 4, 5又は6 -)ピリミジニルカルボニル、6 - オキソ - (1, 2, 3, 4又は5 -)ピリミジニルカルボニル、4 - オキソ - (1, 2, 3, 5又は6 -)ピリミジニルカルボニル、2, 4 - ジオキソ - (1, 3, 4又は6 -)ピリミジニルカルボニル、2, 4, 6 - トリオキソ - (1, 3又5 -)ピリミジニルカルボニル基等のピリミジン環上に置換基としてオキソ基を 1 ~ 3 個有することのあるピリミジニルカルボニル基を例示できる。

10

【0291】

低級アルコキシ低級アルコキシ基としては、例えば、メトキシメトキシ、1 - エトキシエトキシ、2 - メトキシエトキシ、2 - プロポキシエトキシ、3 - イソプロポキシプロポキシ、4 - ブトキシブトキシ、5 - ペンチルオキシペンチルオキシ、6 - ヘキシルオキシヘキシルオキシ、1, 1 - ジメチル - 2 - メトキシエトキシ、2 - メチル - 3 - エトキシプロポキシ、3 - メトキシプロポキシ基等の置換基として炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を有することのある炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

20

【0292】

低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基としては、例えば、メトキシカルボニルメトキシ、エトキシカルボニルメトキシ、2 - メトキシカルボニルエトキシ、2 - エトキシカルボニルエトキシ、1 - エトキシカルボニルエトキシ、3 - メトキシカルボニルプロポキシ、3 - エトキシカルボニルプロポキシ、4 - エトキシカルボニルブトキシ、5 - イソプロポキシカルボニルペンチルオキシ、6 - プロポキシカルボニルヘキシルオキシ、1, 1 - ジメチル - 2 - ブトキシカルボニルエトキシ、2 - メチル - 3 - tert - ブトキシカルボニルプロポキシ、2 - ペンチルオキシカルボニルエトキシ、ヘキシルオキシカルボニルメトキシ基等の2つのアルコキシ部分が共に炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるアルコキシカルボニルアルコキシ基を例示できる。

30

【0293】

カルボキシ低級アルコキシ基としては、例えば、カルボキシメトキシ、2 - カルボキシエトキシ、1 - カルボキシエトキシ、3 - カルボキシプロポキシ、4 - カルボキシブトキシ、5 - カルボキシペンチルオキシ、6 - カルボキシヘキシルオキシ、1, 1 - ジメチル - 2 - カルボキシエトキシ、2 - メチル - 3 - カルボキシプロポキシ基等のアルコキシ部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるカルボキシアルコキシ基を例示できる。

【0294】

フェノキシ低級アルカノイル基としては、例えば、2 - フェノキシアセチル、3 - フェノキシプロピオニル、2 - フェノキシプロピオニル、4 - フェノキシブチリル、5 - フェノキシペンタノイル、6 - フェノキシヘキサノイル、2, 2 - ジメチル - 2 - フェノキシプロピオニル、2 - メチル - 3 - フェノキシプロピオニル基等のアルカノイル部分が炭素数 2 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるフェノキシアルカノイル基を例示できる。

40

【0295】

テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキソ基を有することのある1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリルカルボニル基としては、例えば、[(1, 3, 4, 5, 6, 7又は8 -)1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル]カルボニル、[2 - オキソ - (1, 3

50

, 4, 5, 6, 7又は8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル]カルボニル、[4 - オキソ - (1, 2, 3, 5, 6, 7又は8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル]カルボニル、[2, 4 - ジオキソ - (1, 3, 5, 6, 7又は8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル]カルボニル基等のテトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキソ基を1~2個を有することのある1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリルカルボニル基を例示できる。

【0296】

テトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキソ基を有することのある1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル基としては、例えば、(1, 2, 3, 4, 5, 6, 7又は8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル、2 - オキソ - (1, 3, 4, 5, 6, 7又は8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル、4 - オキソ - (1, 2, 3, 5, 6, 7又は8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル、2, 4 - ジオキソ - (1, 3, 5, 6, 7又は8 -) 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル基等のテトラヒドロキノリン環上に置換基としてオキソ基を1~2個有することのある1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリル基を例示できる。

10

【0297】

置換基として低級アルコキシカルボニル基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミノ、メトキシカルボニルアミノ、エトキシカルボニルアミノ、プロポキシカルボニルアミノ、イソプロポキシカルボニルアミノ、ブトキシカルボニルアミノ、tert - ブトキシカルボニルアミノ、ペンチルオキシカルボニルアミノ、ヘキシルオキシカルボニルアミノ基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基を有することのあるアミノ基を挙げることができる。

20

【0298】

フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を1~3個有することのあるベンゾイル基としては、例えば、ベンゾイル、2 - メトキシベンゾイル、3 - メトキシベンゾイル、4 - メトキシベンゾイル、2 - エトキシベンゾイル、3 - エトキシベンゾイル、4 - エトキシベンゾイル、4 - イソプロポキシベンゾイル、3 - ブトキシベンゾイル、4 - ペンチルオキシベンゾイル、4 - ヘキシルオキシベンゾイル、3, 4 - ジメトキシベンゾイル、3, 4 - ジエトキシベンゾイル、2, 4 - ジメトキシベンゾイル、2, 5 - ジメトキシベンゾイル、2, 6 - ジメトキシベンゾイル、3, 4, 5 - トリメトキシベンゾイル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状のアルコキシ基を1~3個有することのあるベンゾイル基を例示できる。

30

【0299】

フェニル環上に置換基として低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基及び低級アルキルチオ基なる群から選ばれた基を1~3個有していてもよいフェニルを1~2個有する低級アルキル基としては、例えば、前記フェニル低級アルキル基に加え、1, 1 - ジフェニルメチル、1, 1 - ジ(4 - フルオロフェニル)メチル、1 - フェニル - 1 - (4 - メトキシフェニル)メチル、3, 3 - ジフェニルプロピル、2, 5 - ジフルオロベンジル、2, 4 - ジフルオロベンジル、3, 4 - ジフルオロベンジル、3, 5 - ジフルオロベンジル、2, 6 - ジフルオロベンジル、3 - トリフルオロメチルベンジル、2 - トリフルオロメチルベンジル、4 - トリフルオロメチルベンジル、3, 4 - ジメトキシベンジル、3, 5 - ジメトキシベンジル、2 - クロロベンジル、3 - クロロベンジル、4 - クロロベンジル、2 - メチルベンジル、3 - メチルベンジル、4 - メチルベンジル、3, 4 - ジメチルベンジル、2, 3 - ジメチルベンジル、2 - メトキシベンジル、3 - メトキシベンジル、4 - シアノベンジル、2 - シアノベンジル、3 - シアノベンジル、4 - メトキシベンジル、2, 3 - ジクロロベンジル、2, 4 - ジクロロベンジル、2, 5 - ジクロロベンジル、3, 4 - ジクロロベンジル、2, 6 - ジクロロベンジル、4 - フルオロベンジル、3 - フルオロベンジル、2 - フルオロベンジル、4 - ニトロベンジル、3 - ニトロベンジル、2 - ニトロベ

40

50

ンジル、3 - トリフルオロメトキシベンジル、4 - トリフルオロメトキシベンジル、2 -
 トリフルオロメトキシベンジル、4 - メトキシカルボニルベンジル、3 - メトキシカルボ
 ニルベンジル、4 - tert - ブチルベンジル、4 - エチルベンジル、4 - イソプロピル
 ベンジル、4 - メトキシ - 3 - クロロベンジル、2 - (4 - メトキシフェニル) エチル、
 2 - (4 - フルオロフェニル) エチル、2 - (4 - クロロフェニル) エチル、2 - (3 -
 メトキシフェニル) エチル、2 - (4 - メチルフェニル) エチル、4 - フェニルベンジル
 、3 , 3 - ジフェニルプロピル、3 - メチル - 4 - ニトロベンジル、4 - (4 - メトキシ
 フェニル) ブチル、2 - (4 - メチルフェニル) エチル、4 - tert - ブトキシカルボ
 ニルベンジル、3 - クロロ - 6 - メトキシベンジル、4 - ニトロ - 3 - メチルベンジル、
 4 - tert - ブチリルベンジル、2 - (2 - エトキシカルボニルフェニル) エチル、1
 - (3 - プロポキシカルボニルフェニル) エチル、3 - (4 - ペンチルオキシカルボニル
 フェニル) プロピル、4 - (3 - ヘキシロオキシカルボニルフェニル) ブチル、5 - (3
 , 4 - ジメトキシカルボニルフェニル) ペンチル、6 - (3 , 4 , 5 - ジエトキシカルボ
 ニルフェニル) ヘキシル、1 , 1 - ジメチル - 2 - (4 - ブトキシカルボニルフェニル)
 エチル、2 - メチル - 3 - (4 - メトキシカルボニルフェニル) プロピル、2 - (2 - シ
 アノフェニル) エチル、1 - (3 - シアノフェニル) エチル、3 - (4 - シアノフェニル
) プロピル、4 - (2 - シアノフェニル) ブチル、5 - (3 - シアノフェニル) ペンチル
 、6 - (4 - シアノフェニル) ヘキシル、1 , 1 - ジメチル - 2 - (2 , 4 - ジシアノフ
 エニル) エチル、2 - メチル - 3 - (2 , 4 , 6 - トリシアノフェニル) プロピル、2 -
 (2 - ニトロフェニル) エチル、1 - (3 - ニトロフェニル) エチル、3 - (4 - ニトロ
 フェニル) プロピル、4 - (2 - ニトロフェニル) ブチル、5 - (3 - ニトロフェニル)
 ペンチル、6 - (4 - ニトロフェニル) ヘキシル、1 , 1 - ジメチル - 2 - (2 , 4 - ジ
 ニトロフェニル) エチル、2 - メチル - 3 - (2 , 4 , 6 - トリニトロフェニル) プロピ
 ル、2 - (2 - フェニルフェニル) エチル、1 - (3 - フェニルフェニル) エチル、3 -
 (4 - フェニルフェニル) プロピル、4 - (2 - フェニルフェニル) ブチル、5 - (3 -
 フェニルフェニル) ペンチル、6 - (4 - フェニルフェニル) ヘキシル、1 , 1 - ジメチ
 ル - 2 - (2 , 4 - ジフェニルフェニル) エチル、2 - メチル - 3 - (2 , 4 , 6 - トリ
 フェニルフェニル) プロピル、2 - (2 - フルオロフェニル) エチル、1 - (3 - プロモ
 フェニル) エチル、3 - (4 - ヨードフェニル) プロピル、4 - (2 - プロモフェニル)
 ブチル、5 - (3 - クロロフェニル) ペンチル、6 - (4 - プロモフェニル) ヘキシル、
 1 , 1 - ジメチル - 2 - (2 , 4 - ジクロロフェニル) エチル、2 - メチル - 3 - (2 ,
 4 , 6 - トリフルオロフェニル) プロピル、2 - (2 - エチルフェニル) エチル、1 - (3
 - プロピルフェニル) エチル、3 - (4 - ブチルフェニル) プロピル、4 - (2 - ペン
 チルフェニル) ブチル、5 - (3 - ヘキシルフェニル) ペンチル、6 - (4 - トリフルオ
 ロメチルフェニル) ヘキシル、1 , 1 - ジメチル - 2 - (2 , 4 - ジメチルフェニル) エ
 チル、2 - メチル - 3 - [2 , 4 , 6 - トリ (トリフルオロメチル) フェニル] プロピル
 、2 - (2 - エトキシフェニル) エチル、1 - (3 - プロポキシフェニル) エチル、3 -
 (4 - ブトキシフェニル) プロピル、4 - (2 - ペンチルオキシフェニル) ブチル、5 -
 (3 - ヘキシルオキシフェニル) ペンチル、6 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル)
 ヘキシル、1 , 1 - ジメチル - 2 - (2 , 4 - ジメトキシフェニル) エチル、2 - メチル
 - 3 - [2 , 4 , 6 - トリ (トリフルオロメトキシ) フェニル] プロピル、2 - メチルチ
 オベンジル、3 - メチルチオベンジル、4 - メチルチオベンジル、3 , 4 - ジメチルチオ
 ベンジル、2 , 3 - ジメチルチオベンジル、2 - (2 - エチルチオフェニル) エチル、2
 - (4 - メチルチオフェニル) エチル、1 - (3 - プロピルチオフェニル) エチル、3 -
 (4 - ブチルチオフェニル) プロピル、4 - (2 - ペンチルチオフェニル) ブチル、5 -
 (3 - ヘキシルチオフェニル) ペンチル、6 - (4 - メチルチオフェニル) ヘキシル、1
 , 1 - ジメチル - 2 - (2 , 4 - ジメチルチオフェニル) エチル、2 - メチル - 3 - [2
 , 4 , 6 - トリメチルチオフェニル] プロピル、2 - メチル - 4 - シアノベンジル、3 -
 エトキシ - 4 - エトキシカルボニルベンジル、4 - フェニル - 3 - ニトロベンジル、3 -
 フルオロ - 4 - メトキシベンジル、4 - トリフルオロメチル - 3 - シアノベンジル、3 -

10

20

30

40

50

トリフルオロメトキシ - 3 - フルオロベンジル基等の置換基としてフェニル環上に置換基として炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を 1 ~ 3 個有することのある炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、置換基としてハロゲン原子を 1 ~ 3 個有することのある炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基及び炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキルチオ基なる群から選ばれた基を 1 ~ 3 個有していてもよいフェニルを 1 ~ 2 個有する炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0300】

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよいフェニル基としては、例えば、フェニル、2 - メチルフェニル、3 - メチルフェニル、4 - メチルフェニル、2 - エチルフェニル、3 - エチルフェニル、4 - エチルフェニル、4 - イソプロピルフェニル、3 - ブチルフェニル、4 - ペンチルフェニル、4 - ヘキシルフェニル、3, 4 - ジメチルフェニル、3, 4 - ジエチルフェニル、2, 4 - ジメチルフェニル、2, 5 - ジメチルフェニル、2, 6 - ジメチルフェニル、3, 4, 5 - トリメチルフェニル、2 - メトキシフェニル、3 - メトキシフェニル、4 - メトキシフェニル、2 - エトキシフェニル、3 - エトキシフェニル、4 - エトキシフェニル、4 - イソプロポキシフェニル、3 - ブトキシフェニル、4 - ペンチルオキシフェニル、4 - ヘキシルオキシフェニル、3, 4 - ジメトキシフェニル、3, 4 - ジエトキシフェニル、2, 4 - ジメトキシフェニル、2, 5 - ジメトキシフェニル、2, 6 - ジメトキシフェニル、3, 4, 5 - トリメトキシフェニル、2 - トリフルオロメトキシフェニル、3 - トリフルオロメトキシフェニル、4 - トリフルオロメトキシフェニル、2 - (プロモメトキシ)フェニル、3 - (2 - クロロエトキシ)フェニル、4 - (2, 3 - ジクロロプロポキシ)フェニル、4 - (4 - フルオロプロキシ)フェニル、3 - (5 - クロロペンチルオキシ)フェニル、4 - (5 - プロモヘキシルオキシ)フェニル、4 - (5, 6 - ジプロモヘキシルオキシ)フェニル、3, 4 - ジ(トリフルオロメトキシ)フェニル、3, 4 - ジ(4, 4, 4 - トリクロロプロキシ)フェニル、2, 4 - ジ(3 - クロロ - 2 - メトキシプロピル)フェニル、2, 5 - ジ(3 - クロロプロポキシ)フェニル、2, 6 - ジ(2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)フェニル、3, 4, 5 - トリ(トリフルオロメトキシ)フェニル、4 - (2, 2, 2 - トリクロロエトキシ)フェニル、2 - メチル - 4 - トリフルオロメトキシフェニル、3 - エチル - 4 - トリクロロメトキシフェニル、2 - メトキシ - 4 - トリフルオロメトキシフェニル、3 - エトキシ - 4 - トリクロロメトキシフェニル、2 - トリフルオロメチルフェニル、3 - トリフルオロメチルフェニル、4 - トリフルオロメチルフェニル、2 - (プロモメチル)フェニル、3 - (2 - クロロエチル)フェニル、4 - (2, 3 - ジクロロプロピル)フェニル、4 - (4 - フルオロブチル)フェニル、3 - (5 - クロロペンチル)フェニル、4 - (5 - プロモヘキシル)フェニル、4 - (5, 6 - ジプロモヘキシル)フェニル、3, 4 - ジ(トリフルオロメチル)フェニル、3, 4 - ジ(4, 4, 4 - トリクロロブチル)フェニル、2, 4 - ジ(3 - クロロ - 2 - メチルプロピル)フェニル、2, 5 - ジ(3 - クロロプロピル)フェニル、2, 6 - ジ(2, 2, 2 - トリフルオロエチル)フェニル、3, 4, 5 - トリ(トリフルオロメチル)フェニル、4 - (2, 2, 2 - トリクロロエチル)フェニル、2 - メチル - 4 - トリフルオロメチルフェニル、3 - エチル - 4 - トリクロロメチルフェニル等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を 1 ~ 3 個有することのある炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状のアルコキシ基及び置換基としてハロゲン原子を 1 ~ 3 個有することのある炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基なる群より選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよいフェニル基を例示できる。

【0301】

ピロリジン環上に置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基を 1 ~ 3 個有することのあるピロリジニル低級アルキル基としては、例えば、[(1, 2 又は 3 -)ピロリジニル]メチル、2 - [(1, 2 又は 3 -)ピロリジニル]エチル、1 - [(1, 2

10

20

30

40

50

又は 3 -) ピロリジニル] エチル、 3 - [(1 , 2 又は 3 -) ピロリジニル] プロピル、 4 - [(1 , 2 又は 3 -) ピロリジニル] ブチル、 5 - [(1 , 2 又は 3 -) ピロリジニル] ペンチル、 6 - [(1 , 2 又は 3 -) ピロリジニル] ヘキシル、 1 , 1 - ジメチル - 2 - [(1 , 2 又は 3 -) ピロリジニル] エチル、 2 - メチル - 3 - [(1 , 2 又は 3 -) ピロリジニル] プロピル、 [1 - メチル - (2 又は 3 -) ピロリジニル] メチル、 2 - [2 - エチル - (1 , 3 , 4 又は 5 -) ピロリジニル] エチル、 1 - [3 - プロピル - (1 , 2 , 4 又は 5 -) ピロリジニル] エチル、 3 - [1 - ブチル - (2 又は 3 -) ピロリジニル] プロピル、 4 - [2 - ペンチル - (1 , 3 , 4 又は 5 -) ピロリジニル] ブチル、 5 - [3 - ヘキシル - (1 , 2 , 4 又は 5 -) ピロリジニル] ペンチル、 6 - [1 , 2 - ジメチル - (3 , 4 又は 5 -) ピロリジニル] ヘキシル、 1 , 1 - ジメチル - 2 - [1 , 2 , 3 - トリメチル - (4 又は 5 -) ピロリジニル] エチル、 2 - メチル - 3 - [1 - エチル - 2 - メチル - (3 , 4 又は 5 -) ピロリジニル] プロピル、 [1 - (2 - ヒドロキシエチル) - (2 又は 3 -) ピロリジニル] メチル、 [2 - ヒドロキシメチル - (1 , 3 , 4 又は 5 -) ピロリジニル] メチル、 2 - [2 - ヒドロキシメチル - (1 , 3 , 4 又は 5 -) ピロリジニル] エチル、 1 - [3 - (3 - ヒドロキシプロピル) - (1 , 2 , 4 又は 5 -) ピロリジニル] エチル、 3 - [1 - (4 - ヒドロキシブチル) - (2 又は 3 -) ピロリジニル] プロピル、 4 - [2 - (5 - ヒドロキシペンチル) - (1 , 3 , 4 又は 5 -) ピロリジニル] ブチル、 5 - [3 - (6 - ヒドロキシヘキシル) - (1 , 2 , 4 又は 5 -) ピロリジニル] ペンチル、 6 - [1 , 2 - ジヒドロキシメチル - (3 , 4 又は 5 -) ピロリジニル] ヘキシル、 1 , 1 - ジメチル - 2 - [1 , 2 , 3 - トリヒドロキシメチル - (4 又は 5 -) ピロリジニル] エチル、 2 - メチル - 3 - [2 - (1 , 2 - ヒドロキシエチル) - (1 , 3 , 4 又は 5 -) ピロリジニル] プロピル、 [2 - (2 , 3 , 4 - トリヒドロキシブチル) - (1 , 3 , 4 又は 5 -) ピロリジニル] メチル基等のピロリジン環上に置換基として水酸基を 1 ~ 3 個有することのある炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を 1 ~ 3 個有することがあり、アルキル部分が炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるピロリジニルアルキル基を例示できる。

10

20

【 0 3 0 2 】

置換基としてフェニル基及び低級アルキル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ置換低級アルキル基としては、例えば、アミノメチル、 2 - アミノメチル、 1 - アミノエチル、 3 - アミノプロピル、 4 - アミノブチル、 5 - アミノペンチル、 6 - アミノヘキシル、 1 , 1 - ジメチル - 2 - アミノエチル、 N , N - ジエチル - 2 - アミノエチル、 2 - メチル - 3 - アミノプロピル、メチルアミノメチル、 1 - エチルアミノエチル、 2 - プロピルアミノエチル、 3 - イソプロピルアミノプロピル、 4 - ブチルアミノブチル、 5 - ペンチルアミノペンチル、 6 - ヘキシルアミノヘキシル、ジメチルアミノメチル、 2 - ジイソプロピルアミノエチル、 (N - エチル - N - プロピルアミノ) メチル、 2 - (N - メチル - N - ヘキシルアミノ) エチル、フェニルアミノメチル、 1 - フェニルアミノエチル、 2 - フェニルアミノエチル、 3 - フェニルアミノプロピル、 4 - フェニルアミノブチル、 5 - フェニルアミノペンチル、 6 - フェニルアミノヘキシル、 N - メチル - N - フェニルアミノメチル、 2 - (N - エチル - N - フェニルアミノ) エチル、 (N - エチル - N - フェニルアミノ) メチル、 2 - (N - メチル - N - フェニルアミノ) エチル基等の置換基としてフェニル基及び炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群より選ばれた基を 1 ~ 2 個有することのあるアミノ基が置換した炭素数 1 ~ 6 の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

30

40

【 0 3 0 3 】

低級アルキル基上に置換基として水酸基を有することのあるテトラヒドロフリル低級アルキル基としては、例えば、 [(2 又は 3 -) テトラヒドロフリル] メチル、 2 - [(2 又は 3 -) テトラヒドロフリル] エチル、 1 - [(2 又は 3 -) テトラヒドロフリル] エチル、 3 - [(2 又は 3 -) テトラヒドロフリル] プロピル、 4 - [(2 又は 3 -) テトラヒドロフリル] ブチル、 5 - [(2 又は 3 -) テトラヒドロフリル] ペンチル、 6 - [(2 又は 3 -) テトラヒドロフリル] ヘキシル、 1 , 1 - ジメチル - 2 - [(2 又は 3 -

50

）テトラヒドロフリル]エチル、2-メチル-3-[(2又は3-)テトラヒドロフリル]プロピル、1-ヒドロキシ-1-[(2又は3-)テトラヒドロフリル]メチル、2-ヒドロキシ-2-[(2又は3-)テトラヒドロフリル]エチル、2-ヒドロキシ-1-[(2又は3-)テトラヒドロフリル]エチル、3-ヒドロキシ-3-[(2又は3-)テトラヒドロフリル]プロピル、4-ヒドロキシ-4-[(2又は3-)テトラヒドロフリル]ブチル、5-ヒドロキシ-5-[(2又は3-)テトラヒドロフリル]ペンチル、6-ヒドロキシ-6-[(2又は3-)テトラヒドロフリル]ヘキシル、2-ヒドロキシ-1,1-ジメチル-2-[(2又は3-)テトラヒドロフリル]エチル、3-ヒドロキシ-2-メチル-3-[(2又は3-)テトラヒドロフリル]プロピル基等の低級アルキル基上に置換基として水酸基を有することがあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるテトラヒドロフリルアルキル基を例示できる。

【0304】

フェニル環上に置換基として低級アルキル基及びニトロ基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるフェノキシ低級アルキル基としては、例えば、前記フェノキシ低級アルキル基に加えて、2-メチルフェノキシメチル、3-メチルフェノキシメチル、4-メチルフェノキシメチル、3,4-ジメチルフェノキシメチル、2,3-ジメチルフェノキシメチル、3,4,5-トリメチルフェノキシメチル、2-(2-エチルフェノキシ)エチル、2-(3-メチルフェノキシ)エチル、2-(4-メチルフェノキシ)エチル、1-(3-プロピルフェノキシ)エチル、3-(4-ブチルフェノキシ)プロピル、4-(2-ペンチルフェノキシ)ブチル、5-(3-ヘキシルフェノキシ)ペンチル、6-(4-メチルフェノキシ)ヘキシル、1,1-ジメチル-2-(2,4-ジメチルフェノキシ)エチル、2-メチル-3-(2,4,6-トリメチルフェノキシ)プロピル、2-(4-ニトロ-3-メチルフェノキシ)エチル、4-ニトロフェノキシメチル、3-ニトロフェノキシメチル、2-ニトロフェノキシメチル、2-(2-ニトロフェノキシ)エチル、2-(4-ニトロフェノキシ)エチル、1-(3-ニトロフェノキシ)エチル、3-(4-ニトロフェノキシ)プロピル、4-(2-ニトロフェノキシ)ブチル、5-(3-ニトロフェノキシ)ペンチル、6-(4-ニトロフェノキシ)ヘキシル、1,1-ジメチル-2-(2,4-ジニトロフェノキシ)エチル、2-メチル-3-(2,4,6-トリニトロフェノキシ)プロピル等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基及びニトロ基なる群から選ばれた基を1~3個有することがあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェノキシアルキル基を例示できる。

【0305】

フェニル低級アルカノイル基としては、例えば、2-フェニルアセチル、3-フェニルプロピオニル、2-フェニルプロピオニル、4-フェニルブチリル、5-フェニルペンタノイル、6-フェニルヘキサノイル、2,2-ジメチル-3-フェニルプロピオニル、2-メチル-3-フェニルプロピオニル基等のアルカノイル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であるフェニルアルカノイル基を例示できる。

フェニル環上に、置換基としてハロゲン原子及びハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群から選ばれた基が1~3個有することのあるフェニル基としては、例えば、フェニル、3,4-ジフルオロフェニル、2-フルオロフェニル、3-ブromoフェニル、4-ヨードフェニル、4-メチルフェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、2-エチルフェニル、3-エチルフェニル、4-エチルフェニル、4-イソプロピルフェニル、3-ブチルフェニル、4-ペンチルフェニル、4-ヘキシルフェニル、3,4-ジメチルフェニル、3,4-ジエチルフェニル、2,4-ジメチルフェニル、2,5-ジメチルフェニル、2,6-ジメチルフェニル、3,4,5-トリメチルフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、2-(ブromoメチル)フェニル、3-(2-クロロエチル)フェニル、4-(2,3-ジクロロプロピル)フェニル、4-(4-フルオロブチル)フェニル、3-(5-クロロペンチル)フェニル、4-(5-ブromoヘキシル)フェニル、4-(5,6-

10

20

30

40

50

ジブromoヘキシル)フェニル、3, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェニル、3, 4-ジ(4, 4, 4-トリクロロプロチル)フェニル、2, 4-ジ(3-クロロ-2-メチルプロピル)フェニル、2, 5-ジ(3-クロロプロピル)フェニル、2, 6-ジ(2, 2, 2-トリフルオロエチル)フェニル、3, 4, 5-トリ(トリフルオロメチル)フェニル、4-(2, 2, 2-トリクロロエチル)フェニル、2-メチル-4-トリフルオロメチルフェニル、3-エチル-4-トリクロロメチルフェニル、2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェニル、3-エチル-4-フルオロフェニル、3-フルオロ-4-トリクロロメチルフェニル、2-メチル-3-トリフルオロメチル-4-トリフルオロメチルフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2-ブromoフェニル、4-ブromoフェニル、2-ヨードフェニル、3-ヨードフェニル、2, 3-ジブromoフェニル、2, 4-ジヨードフェニル、2, 5-ジフルオロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、2, 4, 6-トリクロロフェニル、2, 4-ジフルオロフェニル、3, 5-ジフルオロフェニル、2, 6-ジフルオロフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2, 3-ジクロロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、2, 5-ジクロロフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、3, 5-ジクロロフェニル、2, 4, 6-トリフルオロフェニル、2, 4-ジフルオロフェニル基等フェニル環上に、置換基としてハロゲン原子及びハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基及びなる群から選ばれた基が1~3個有することのあるフェニル基を例示できる。

10

【0306】

20

R^{20} 及び R^{21} 、 R^{22} 及び R^{23} 、 R^{26} 及び R^{27} 、 R^{29} 及び R^{30} 又は R^{32} 及び R^{33} が結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成される5~7員の飽和複素環基としては、例えば、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリノ、チオモルホリノ、ホモピペラジニル基等を例示できる。

【0307】

フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェノキシ低級アルキル基としては、例えば、前記フェノキシ低級アルキル基に加えて、2-メチルフェノキシメチル、3-メチルフェノキシメチル、4-メチルフェノキシメチル、3, 4-ジメチルフェノキシメチル、2, 3-ジメチルフェノキシメチル、3, 4, 5-トリメチルフェノキシメチル、2-(2-エチルフェノキシ)エチル、2-(4-メチルフェノキシ)エチル、1-(3-プロピルフェノキシ)エチル、3-(4-ブチルフェノキシ)プロピル、4-(2-ペンチルフェノキシ)ブチル、5-(3-ヘキシルフェノキシ)ペンチル、6-(4-メチルフェノキシ)ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-(2, 4-ジメチルフェノキシ)エチル、2-メチル-3-(2, 4, 6-トリメチルフェノキシ)プロピル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状のアルキルを1~3個有することがあり、アルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェノキシアルキル基を例示できる。

30

一般式(1)の化合物のうち、下記の化合物又はその塩がより好ましい。

X_1 は、窒素原子又は基 - CH = を示す。

40

R^1 は、基 - Z - R^6 を示す。

Z は、基 - N(R^8) - B -、基 - B - N(R^8) -、基 - B₀ - O -、基 - N(R^{9a}) - CO - N(R^{9b}) - を示す。

R^8 は、水素原子、置換基として低級アルコキシ基を有することのある低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルキルスルホニル基又はフェニル低級アルキル基を示す。

B は、基 - CO - 又は低級アルキレン基を示す。

B₀ は、低級アルキレン基を示す。

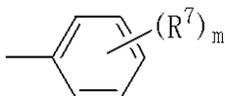
R^{9a} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

R^{9b} は、水素原子又は低級アルキル基を示す。

R^6 は、基

50

【化 5 8】



を示す。

R^7 は、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、を示す。

m は、1 または 2 の整数を示す。 m が 2 を示す場合、2 個の R^7 は、同一であってもよいし、異なってもよい。

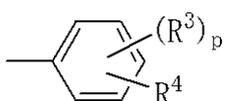
R^2 は、水素原子、ハロゲン原子又は低級アルキル基を示す。

Y は、基 - O - 、基 - N (R^5) - 、を示す。

R^5 は、水素原子、低級アルキル基、を示す。

A は、基

【化 5 9】



を示す。

p は、1 又は 2 を示す。

R^3 は、水素原子、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、を示す。

R^4 は、基 - (T)₁ - N (R^{14}) R^{15} を示す。

T は、基 - N (R^{17}) - B₃ - CO - 、基 - B₄ - CO - 、基 - CO - 、を示す。

R^{17} は、水素原子、低級アルキル基、を示す。

B₃ は、低級アルキレン基を示す。

B₄ は、低級アルケニレン基又は置換基として水酸基を有することのある低級アルキレン基を示す。

l は、0 又は 1 を示す。

R^{14} は、水素原子又は置換基として水酸基を有することのあるアルキル基を示す。

R^{15} は、(36a) ピペラジン環上に置換基としてフェニル低級アルキル基 (フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基及び低級アルコキシ基からなる群から選ばれた基を 1 ~ 3 個有していてもよい) 及びピリジル低級アルキル基からなる群から選ばれた基を 1 ~ 3 個有することのあるピペラジニル置換オキサリル基を示す。

R^{14} と R^{15} とは、これらが結合する窒素原子と共に、ピペラジニル基またはピペリジニル基である複素環基を形成する。

該複素環上には、(28) フェニル環上に置換基として低級アルカノイル基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシカルボニル基、シアノ基、ニトロ基、フェニル基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルコキシ基、フェニル低級アルコキシ基、水酸基及び低級アルキレンジオキシ基からなる群から選ばれた基が置換していてもよいフェニル置換低級アルキル基、(49) 基 - (B₁₂ CO) t - N (R^{20}) R^{21} 、(84) 基 - (O - B₁₅) s - CO - N (R^{26}) R^{27} 、からなる群から選ばれた基が置換していてもよい。

B₁₂ は、低級アルキレン基を示す。

t は、0 又は 1 を示す。

R^{20} と R^{21} とは、これらが結合する窒素原子と共に、ピペラジニル基、ピペリジニル基である飽和複素環を形成する。該複素環上には、フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基が置換していてもよい。

B₁₅ は、低級アルキレン基を示す。

s は、0 又は 1 を示す。

10

20

30

40

50

R^{26} 及び R^{27} は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、フェニル低級アルキル基又はイミダゾリル低級アルキル基を示す。また、 R^{26} と R^{27} とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基を1～3個有していてもよい。

例えば、更に好ましい化合物(1)は、下記の化合物又はその塩である。

X_1 は、窒素原子を示す。

R^1 は、基 - Z - R^6 を示す。

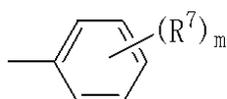
Z は、基 - N(R^8) - B - を示す。

R^8 は、水素原子、置換基として低級アルコキシ基を有することのある低級アルキル基を示す。

B は、基 - CO - を示す。

R^6 は、基

【化60】



を示す。

R^7 は、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、を示す。

m は、1または2の整数を示す。mが2を示す場合、2個の R^7 は、同一であってもよいし、異なってもよい。

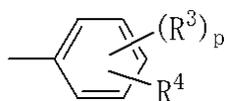
R^2 は、水素原子を示す。

Y は、基 - O -、基 - N(R^5) - を、示す。

R^5 は、水素原子、低級アルキル基、を示す。

A は、基

【化61】



を示す。

p は、1又は2を示す。

R^3 は、水素原子、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、を示す。

R^4 は、基 - (T)₁ - N(R^{14}) R^{15} を示す。

T は、基 - N(R^{17}) - B₃ - CO -、基 - B₄ - CO -、基 - CO -、を示す。

R^{17} は、水素原子、低級アルキル基、を示す。

R_3 は、低級アルキレン基を示す。

B₄ は、置換基として水酸基を有することのある低級アルキレン基を示す。

l は、0又は1を示す。

R^{14} と R^{15} とは、これらが結合する窒素原子と共に、ピペラジニル基またはピペリジニル基である複素環基を形成する。

該複素環上には、(28) フェニル環上に低級アルキレンジオキシ基が置換していてもよいフェニル置換低級アルキル基が置換していてもよい。

別のより好ましい化合物(1)としては、例えば下記の化合物又はその塩である。

X_1 は、窒素原子を示す。

R^1 は、基 - Z - R^6 を示す。

Z は、基 - N(R^8) - B - を示す。

R^8 は、水素原子、置換基として低級アルコキシ基を有することのある低級アルキル基を

10

20

30

40

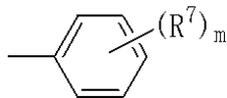
50

示す。

B は、基 - C O - を示す。

R⁶ は、基

【化 6 2】



を示す。

R⁷ は、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、を示す。

m は、1 または 2 の整数を示す。m が 2 を示す場合、2 個の R⁷ は、同一であってもよいし、異なってもよい。

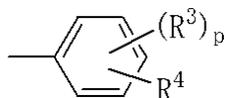
R² は、水素原子を示す。

Y は、基 - O - 、基 - N (R⁵) - 、を示す。

R⁵ は、水素原子、低級アルキル基、を示す。

A は、基

【化 6 3】



を示す。

p は、1 又は 2 を示す。

R³ は、水素原子、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、を示す。

R⁴ は、基 - (T)₁ - N (R^{1 4}) R^{1 5} を示す。

R^{1 7} は、水素原子、低級アルキル基、を示す。

B₃ は、低級アルキレン基を示す。

B₄ は、置換基として水酸基を有することのある低級アルキレン基を示す。

l は、0 を示す。

R^{1 4} と R^{1 5} とは、これらが結合する窒素原子と共に、ピペラジニル基またはピペリジニル基である複素環基を形成する。

該複素環上には、(49) 基 - (B_{1 2} C O)_t - N (R^{2 0}) R^{2 1}、(84) 基 - (O - B_{1 5})_s - C O - N (R^{2 6}) R^{2 7}、からなる群から選ばれた基が 1 個置換していてもよい。

B_{1 2} は、低級アルキレン基を示す。

t は、0 又は 1 を示す。

R^{2 0} と R^{2 1} とは、これらが結合する窒素原子と共に、ピペラジン、ピペリジンである飽和複素環を形成する。該複素環上には、フェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基が 1 個置換していてもよい。

B_{1 5} は、低級アルキレン基を示す。

s は、0 又は 1 を示す。

R^{2 6} 及び R^{2 7} は、これらが結合する窒素原子と共に、酸素原子又は窒素原子を介し又は介することなく互いに結合して 6 員の飽和複素環を形成する。該複素環上には、置換基としてフェニル環上に置換基として低級アルキレンジオキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基を 1 ~ 3 個有していてもよい。

【0308】

本発明の S T A T 3 / 5 活性化阻害剤に含まれる芳香族化合物 (1) 又はその塩は、立体異性体、光学異性体、及び溶媒和物 (水和物、エタノレート等) を包含する。

【0309】

芳香族化合物 (1) のうち塩基性基を有する化合物は、通常の薬理的に許容される酸と

10

20

30

40

50

容易に塩を形成し得る。斯かる塩としては、例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩、硝酸塩、硫酸塩、リン酸塩等の無機酸塩、メタンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、酢酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、リンゴ酸塩、乳酸塩等の有機酸塩等が挙げられる。

【0310】

また芳香族化合物(1)のうち酸性基を有する化合物は、医薬的に許容される塩基性化合物を作用させることにより容易に塩を形成させることができる。斯かる塩としては、例えばナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩等を挙げることができる。

【0311】

芳香族化合物(1)又はその塩は、WO2006/014012記載と同様の方法により調製することができる。

10

【0312】

次に、芳香族化合物(1)又はその塩を有効成分として含有する医療製剤について説明する。

【0313】

上記医療製剤は、芳香族化合物(1)又はその塩を通常の医療製剤の形態に製剤したものであって、通常使用される充填剤、増量剤、結合剤、付湿剤、崩壊剤、表面活性剤、滑沢剤等の希釈剤あるいは賦形剤を用いて調製される。

【0314】

このような医療製剤としては、治療目的に応じて種々の形態の中から選択でき、その代表的なものとして錠剤、丸剤、散剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤、カプセル剤、坐剤、注射剤(液剤、懸濁剤等)等が挙げられる。

20

【0315】

錠剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、乳糖、白糖、塩化ナトリウム、ブドウ糖、尿素、デンプン、炭酸カルシウム、カオリン、結晶セルロース等の賦形剤、水、エタノール、プロパノール、単シロップ、ブドウ糖液、デンプン液、ゼラチン溶液、カルボキシメチルセルロース、セラック、メチルセルロース、リン酸カリウム、ポリビニルピロリドン等の結合剤、乾燥デンプン、アルギン酸ナトリウム、寒天末、ラミナラン末、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸モノグリセリド、デンプン、乳糖等の崩壊剤、白糖、ステアリン、カカオバター、水素添加油等の崩壊抑制剤、第4級アンモニウム塩基、ラウリル硫酸ナトリウム等の吸収促進剤、グリセリン、デンプン等の保湿剤、デンプン、乳糖、カオリン、ベントナイト、コロイド状ケイ酸等の吸着剤、精製タルク、ステアリン酸塩、ホウ酸末、ポリエチレングリコール等の滑沢剤等が挙げられる。

30

【0316】

更に、錠剤は、必要に応じて通常の錠皮を施した錠剤、例えば、糖衣剤、ゼラチン被包錠、腸溶被錠、フィルムコーティング錠あるいは二重錠、多層錠とすることができる。

丸剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、ブドウ糖、乳糖、デンプン、カカオ脂、硬化植物油、カオリン、タルク等の賦形剤、アラビアゴム末、トラガント末、ゼラチン、エタノール等の結合剤、ラミナラン、寒天等の崩壊剤等が挙げられる。

40

【0317】

坐剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、ポリエチレングリコール、カカオ脂、高級アルコール、高級アルコールのエステル類、ゼラチン、半合成グリセライド等が挙げられる。

【0318】

注射剤として調製される場合は、液剤、乳剤及び懸濁剤は殺菌され、かつ血液と等張であるのが好ましい。これらの液剤、乳剤及び懸濁剤の形態に成形する際に用いられる希釈剤としては、公知のものを広く用いられているものを使用することができ、例えば、水、

50

エタノール、プロピレングリコール、エトキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシエチレンソルベタン脂肪酸エステル類等が挙げられる。なお、この場合、等張性の溶液を調製するのに十分な量の食塩、ブドウ糖あるいはグリセリンを医薬製剤中に含有させてもよく、また通常の溶解補助剤、緩衝剤、無痛化剤等を、更に必要に応じて着色剤、保存剤、香料、風味剤、甘味剤等や他の医薬品を含有させてもよい。

【0319】

医療製剤中に含有される芳香族化合物(1)又はその塩の量は、特に限定されず広い範囲内から適宜選択することができるが、通常、医療製剤中に芳香族化合物(1)又はその塩を1~70重量%含有させるのが好ましい。

10

【0320】

本発明に係る医療製剤の投与方法としては特に制限はなく、各種製剤形態、患者の年齢、性別、疾患の状態、その他の条件に応じた方法で投与される。例えば、錠剤、丸剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤及びカプセル剤の場合には経口投与される。また、注射剤の場合には、単独であるいはブドウ糖、アミノ酸等の通常の補液と混合して静脈内に投与したり、更には必要に応じて単独で筋肉内、皮内、皮下もしくは腹腔内に投与することができる。坐剤の場合には、直腸内に投与される。

【0321】

上記医療製剤の投与量は、用法、患者の年齢、性別、疾患の程度、その他の条件に応じて適宜選択すればよく、通常、1日あたり体重1kgに対して0.001~100mg、好ましくは0.001~50mgを1回~数回に分けて投与される。

20

【0322】

上記投与量は、種々の条件で変動するので、上記範囲より少ない投与量で十分な場合もあるし、また上記範囲を超えた投与量が必要な場合もある。

【0323】

本発明における芳香族化合物(1)又はその塩は、STAT3/5活性化阻害作用を有し、STAT3/5活性化阻害剤として有用である。

【0324】

芳香族化合物(1)又はその塩は、そのSTAT3活性化阻害作用から、自己免疫疾患、糖尿病、感染症、中枢性疾患、癌関連疾患又は乾癬等の予防薬又は治療薬として有用である。

30

【0325】

自己免疫疾患としては、自己免疫性血液疾患(例えば溶血性貧血、再生不良性貧血、特発性血小板減少症等)、リウマチ、全身性エリテマトーデス、多発性軟骨症、強皮症、ウエグネル肉芽腫症、皮膚筋炎、慢性活動性肝炎、重症筋無力症、スチーブンス・ジョンソン症候群、特発性スプルー、炎症性腸疾患(例えば潰瘍性大腸炎、クローン病等)、内分泌性眼病、グレーブス病、サルコイドーシス、多発性硬化症、原発性胆汁性肝硬変、若年性糖尿病(I型糖尿病)、ぶどう膜炎(前および後ぶどう膜炎)、乾性角結膜炎、春季角結膜炎、乾癬性関節炎および糸球体腎炎(ネフローゼ症状を伴うものおよび伴わないもの、例えば特発性ネフローゼ症候群又は微少変化ネフロパシー等)が挙げられる。

40

【0326】

中枢性疾患としては、アルツハイマー病が挙げられる。

【0327】

癌関連疾患としては、悪液質が挙げられる。

【0328】

感染症としては、C型肝炎ウイルス(HCV)感染症、カポジ肉腫関連ヘルペスウイルス(Kaposi's sarcoma-associated herpesvirus)(KSHV)感染症等が挙げられる。

更に、本発明の化合物は、STAT5活性化阻害作用を有し、STAT5活性化阻害剤として有用である。具体的には、前記のような自己免疫疾患、アレルギー、炎症、高プロラクチン血症、等に対する予防薬又は治療薬として有用である。

50

【 0 3 2 9 】

本発明においては、芳香族化合物（ 1 ）又はその塩は、他の S T A T 3 活性化阻害剤、S T A T 3 活性阻害剤、免疫抑制剤、抗炎症剤、糖尿病治療薬、感染症治療薬、中枢性疾患治療薬、癌関連疾患治療薬、乾癬治療剤、抗腫瘍剤、線維化抑制剤等と併用することができる。

【 0 3 3 0 】

本出願で引用した特許、特許出願および文献は、参考として挿入される。

【実施例 1】

【 0 3 3 1 】

HepG2細胞におけるIL - 6刺激後の核内活性化STAT3量に及ぼす試験化合物の影響

10

1) 培養

Hep G2細胞をPBS(-)で2回洗浄後、トリプシン/EDTA溶液で一回洗浄し、トリプシン/EDTA溶液で細胞を剥がす。細胞を遠心後、抗生物質添加培地(MEM培地(10%FBS+抗生物質(100U/mLペニシリン+100 µg/mLストレプトマイシン)))に懸濁し、細胞数をカウント後、12ウェルプレートに1ウェル当り 1.2×10^5 細胞/1mLの密度で播種する。

播種から2日後、培養培地を抗生物質未添加培地(MEM培地(10%FBS))の1 mlに交換する。

2) 試験化合物添加

培地交換2日後に試験化合物を、0、1、10及び100nMとなるように加える。

試験化合物添加の3時間後にIL-6(株式会社鎌倉テクノサイエンス、Code No. KTS102S)を最終濃度0または500ng/mLとなるように加える。

20

IL - 6添加の5分後にNuclear Extract Kit(Active Motif社製、Code No. 40410)用いて抽出する。

3) 核画分抽出

細胞上清を吸引除去する。細胞を1 mLの氷冷したホスファターゼインヒビター含有PBS(以下、PBS/ホスファターゼインヒビター)で洗浄し、再度細胞上清を吸引する。

セルスクレーパーで細胞を氷冷PBS/ホスファターゼインヒビター0.6 mL中に集め、予め氷冷した1.5 mLのマイクロチューブに移す。

400 × g、5分間、4 遠心後、上清を除去する。

数回ピペッティングすることにより、低張液0.2 mL中に細胞を再懸濁させ、氷上で15分間放置する。

30

この懸濁液にデタージェント10 µLを加え、10秒間、攪拌する。20,400 × g、30秒間、4 遠心後、上清を除去する。

得られた細胞にComplete Lysis Buffer 50 µLを加え、懸濁液をピペッティング後、10秒間攪拌した後、氷上で30分間振とうする。

30秒間攪拌後、20,400 × g、10分間、4 で遠心する。

上清を予め氷冷した1.5 mLのマイクロチューブに分注後、-80 にて保存する。

4) TransAM STAT3 Kit(Active Motif社製、Code No. 45196)を用いてDNA結合性を測定する。

ELISAプレートの各ウェルにComplete Binding Buffer 30 µL、サンプル(核抽出)20 µLを添加する。

40

ポジティブコントロール : Hep G2 nuclear extract (2.5mg/mL)10 µLをComplete Lysis Buffer 40 µLで希釈する(10 µg/20 µL)。順次1/2希釈することにより、5、2.5、1.25、0.625及び0.313 µg/20 µLの希釈液を調製し、その20 µLずつを各ウェルに添加する。

ブランクウェル : Complete Lysis Buffer 20 µLを添加する。

プレートをシールした後、室温でゆっくりプレートを1時間振とうする。その後、洗浄バッファー200 µLで3回洗浄する。

STAT3抗体100 µLを加え、プレートをシールした後、室温でゆっくりプレートを振とうする。1時間後、洗浄バッファー200 µLで3回洗浄する。洗浄後HRP-conjugated抗体100 µLを加え、プレートをシールした後、室温でゆっくりプレートを1時間振とうする。その

50

後洗浄バッファ-200 μL で4回洗浄する。

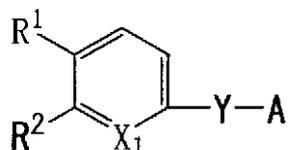
室温に戻した発色液100 μL を加え、遮光下でプレートを2 - 10分間放置する。発色を確認後、停止液100 μL を加え、5分以内に450及び630nmで吸光度を測定する。

5) 下記表1に示す試験化合物を用いた場合の結果を表2に示す。

【0332】

【表1】

・試験化合物



10

試験化合物 No ()*	R ¹	R ²	X ₁	-Y-A
1 (Ex. 582)		H-	N	
2 (Ex. 1039)		H-	N	
3 (Ex. 322)		H-	N	
4 (Ex. 1503)		H-	N	
5 (Ex. 1049)		H-	CH	
6 (Ex. 940)		H-	N	
7 (Ex. 2228)		H-	N	
8 (Ex. 1202)		H-	N	

20

30

40

* : ()中番号はWO2006/014012中の実施例番号

【0333】

50

【表 2】

・結果

試験化合物 No.	IC ₅₀ (nM)
1	< 150
2	< 150
3	< 150
4	< 150
5	< 150
6	< 150
7	< 150
8	< 150

10

【実施例 2】

【0334】

試験化合物によるSTAT3リン酸化抑制効果

(1)細胞

・細胞の播種

Hep G2細胞をPBS(-)で2回洗浄後、トリプシン/EDTAで洗浄除去し、更にトリプシン/EDTAで細胞を剥がす。この細胞を遠心後、抗生物質添加培地(MEM培地(10% FBS + 抗生物質(100 U/mLペニシリン + 100 μg/mLストレプトマイシン)))に懸濁し、細胞数をカウント後、6ウェルプレートに1ウェル当たり 2.4×10^5 /2mLずつ播種する。

20

2日後、抗生物質添加培地を抗生物質未添加培地(MEM培地(10%FBS))に交換する。

・細胞の薬剤処理

培地交換2日後に試験化合物を0、1、10及び100nMとなるように加える。

試験化合物添加の3時間後にIL-6(株式会社鎌倉テクノサイエンス、Code No. KTS102S)を100ng/mLとなるように加える。

・細胞の回収

IL-6添加の5分後に冷却したPBS(-)を用いて細胞を2回洗浄し、スクレーパーを用いて細胞をプレートより剥がす。PBS(-)を用いて細胞を1.5 mLのマイクロチューブに回収する。1.5 mLのマイクロチューブに回収した細胞を遠心し、上清を除去する。1.5 mLのマイクロチューブに回収した細胞は、使用するまで極低温フリーザーで凍結保存する。

30

・Lysis処理

凍結細胞にRIPA bufferを加える。26G×1/2注射針付き1mLシリンジを用いて凍結細胞を懸濁後、懸濁液を氷水中で30~60分間放置する。細胞懸濁液を遠心し、上清(cell lysate)を新しいチューブに移す。チューブに回収したcell lysateは、使用するまで極低温フリーザーで凍結保存する。

・タンパク濃度測定

各cell lysateのタンパク量は、BCAプロテインアッセイ試薬セットに添付されているプロトコールに準じて定量する。

40

(2)ウェスタンブロッティング測定

・PAGE(電気泳動)

各cell lysateのタンパク量を一定にした後、還元条件下で変性処理する。

サンプル及び分子量マーカーをポリアクリルアミドゲルにアプライ後泳動を行う。

・ブロッティング

電気泳動終了後、転写に用いる溶液にて平衡化を行う。

セミドライ型転写装置を用いてポリアクリルアミドゲルに展開されたタンパク質をPVDF(polyvinylidene difluoride)膜に転写させる。

・ブロッキング・洗浄

50

PVDF膜を洗浄後、ブロッキングバッファー(5%BSA)に浸してブロッキングする。

- ・ 1次抗体 (Phospho - STAT3(Ser727)Antibody、又はPhospho - STAT3(Tyr705)Antibody) ブロッキングしたPVDF膜を、1次抗体と反応させる。

- ・ 2次抗体 (Anti-rabbit-IgG HRP-linked Antibody) ・ 洗浄 PVDF膜を洗浄後、HRP標識抗体と反応させる。

- ・ ECLによる発色・検出

PVDF膜を洗浄後、ECL Western Blotting Detection Reagentsを用いて発色を行い、LAS-3000により蛍光の検出を行う。

- ・ 上記の方法に従い、試験化合物によるSTAT3リン酸化抑制効果を測定する。

【実施例3】

【0335】

22Rv1細胞におけるプロラクチン刺激によるSTAT5活性化に及ぼす試験化合物の影響

1) 培養

凍結保存してある22Rv1細胞を2回以上継代培養後試験に用いる。サブコンフルエントに達するまで培養後、細胞をD-PBS(-)で洗浄する。その後、トリプシン-EDTA溶液で細胞を剥がし、培地(RPMI-1640培地(10%FBS+抗生物質(100U/mLペニシリン+100µg/mLストレプトマイシン))にて懸濁する。細胞懸濁液を150×g、5分間、20~25にて遠心分離し上清を除き、培地に再懸濁する。細胞懸濁液の一部を取りトリパンプにて死細胞を染色し、血球計算板を用いて生細胞数をカウントする。細胞が 2×10^5 個/mLになるように細胞懸濁液を調製し、12ウェルプレートに 2×10^5 個/1mL/ウェルずつ播種する。CO₂インキュベータ内(5% CO₂, 37)にて培養する。

2) 試験化合物添加

播種2日後に試験化合物を、0及び1000 nMとなるように加える。

試験化合物添加の3時間後にリコンビナントヒトプロラクチン(rhPRL,R&D Systems, 1nc)を0または250 ng/mLとなるように加える。

3) 細胞質画分抽出

プロラクチン添加の15分後にNuclear Extract Kit(Active Motif社製、Code NO.40410)を用いて抽出する。プロラクチンの添加15分後に上清を取り除き、氷冷PBS/ホスファターゼインヒビター1 mLを添加してプロラクチン刺激をただちに停止する。氷冷PBS/ホスファターゼインヒビター1 mLを吸引後、0.6mLの氷冷PBS/ホスファターゼインヒビターを加え、200×g、5分間、4にて遠心する。

上消除去後、Hypotonic Buffer 0.2mLを加え懸濁する。氷上で15分間放置後detergent 10 µLを加え、更に攪拌後、14,000×g、1分間、4にて遠心する。得られた上清(細胞質画分)を予め氷冷した96ウェルプレート3枚に分注後、-80フリーザーで保存する。

4) 活性化 STAT5 測定

測定にはTransAM™STAT family Kitの付属試薬を用いる。即ち、TransAM™STAT family kitのELISAプレートの各ウェルにComplete Binding Buffer 30 µLを添加後、細胞質画分20 µLを添加する。検量線サンプルとして、TransAM™STAT family kit添付の細胞該画分標準品{Nb2核画分(prolactin stimulated, 2.5 µg/ µL)} 12 µLをComplete Lysis Buffer 48 µLで希釈後(10 µg/20 µL)、更に順次1/2希釈することで5, 2.5, 1.25, 0.625, 0.313, 0.156 µg/20 µLを調製し、ウェルに20 µLずつ添加する。ブランクとして、Complete Lysis Buffer 20 µLを添加する。サンプル添加後、プレートをシールし、室温でゆっくり1時間振とうする。その後、Wash Buffer 200 µLで3回洗浄する。次にSTAT5B抗体 100 µLを加えシール後、室温で静置する。1時間後、Wash Buffer 200 µLで3回洗浄し、Horseradish Peroxidase(HRP)-conjugated抗体 100 µLを加えシール後、更に室温で静置する。1時間後、Wash Buffer 200 µLで4回洗浄し、Developing Solution 100 µLを加え、遮光下 2-10分間放置する。発色を確認後、Stop Solution 100 µLを加え、直ちにプレートリーダーを用いて、450 nm(測定波長)及び 630 nm(参照波長)で吸光度を測定する。

検量線よりリン酸化 STAT5B 二量体量を見積もり、更に薬剤未添加時のリン酸化 STAT5

10

20

30

40

50

B 二量体量に対する各薬剤添加時の同二量体との比 (T/C %) を算出する。表 1 中の試験化合物を用いた結果を表 3 に示す。

【表 3】

試験化合物 No.		T/C %
対象 (DMSO)	0	100
1	1000 nM	<30
2	1000 nM	<30
3	1000 nM	<30
4	1000 nM	<30
5	1000 nM	<30
6	1000 nM	<30
7	1000 nM	<30
8	1000 nM	<30

10

【実施例 4】

【0336】

20

デキストラン硫酸ナトリウム (DSS) 誘発大腸炎モデルに対する試験化合物の効果

1. DSSによる大腸炎の誘導

雌性 C57BL/6J Jms Slcを 1 週間の予備飼育終了後、群分け当日のマウスの体重 (BW) を基準として、層別無作為化法にて各群にマウスの割り付けを行う。

DSS (MP Biomedicals, Lot No.4556J) を大塚蒸留水に溶解し、4% 溶液を調製する。4% DSS 溶液をマウスに投与開始翌日 (Day 2) から 7 日間自由飲水することにより、大腸炎を誘発させる。

2. 試験化合物及び溶媒の投与

DSS 溶液投与前 (Day 1) および DSS 投与後の最新の体重を基に、各投与液を 10 mL/kg の投与量で 1 日 1 回経口投与する。

30

試験化合物の投与用量は 300mg/kg とする。

投与液は、被験物質が 30mg/mL となるように 5% アラビアゴム溶液に懸濁して調製する。

3. 剖検

剖検は Day 8 に行う。

4. 採血

ジエチルエーテル麻酔下、腹部後大静脈より採血後、BD マイクロティナ (登録商標) (日本ベクトン・ディッキンソン株式会社) に直ちに移し、転倒混和し氷中に静置する。冷却遠心機 (HITACHI, CF9RX, T3S51 ローター) を用いて遠心し (4℃, 2, 150 × g, 20min)、ヘパリン血漿を得る。分注した血漿は、測定に供するまで -80℃ フリーザーにて凍結保存する。

40

5. 臓器採取

ジエチルエーテル麻酔下、腹部後大動静脈切断による放血致死後、脾臓を摘出し、電子天秤にてその重量を測定する。次いで大腸をただちに取り除き、大腸の長さを測定し、大腸の縮小を評価した。

6. 測定項目

・体重

電子天秤を用いて、Day 1 (群分け日)、3、5、7 及び 8 (剖検日) に測定する。

Day 1 (群分け日) の体重と Day 8 (剖検日) の体重から体重変化を算出する。

・脾臓重量

50

電子天秤にて脾臓の湿重量を測定する。

また、脾臓重量の測定結果から脾臓重量の Control 群の平均脾臓重量に対する比率 (T/C %) および脾臓重量増加抑制率 (IR%) を算出する。

・大腸の長さ

定規にて大腸の長さを測定する。

また、大腸の長さの測定結果から Control 群の平均の大腸の長さに対する比率 (T/C %) および大腸縮小抑制率 (IR%) を算出する。

試験化合物の結果を表 4 に示す。

【表 4】

試験化合物No.	脾臓重量増加抑制率 IR (%)
9 (WO2006/014012の実施例305)	>40
10 (WO2006/014012の実施例1105)	>40
11 (WO2006/014012の実施例1503)	>40

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/JP2007/069645

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D317/58 C07D405/12		
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) C07D		
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 practical, search terms used) EPO-Internal, BEILSTEIN Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 3 182 085 A (PITCHFORTH JR LEHI L) 4 May 1965 (1965-05-04) column 2; example 1	1
X	WO 03/076406 A (MERCK PATENT GMBH [DE]; LARDY CLAUDE [FR]; FESTAL DIDIER [FR]; CAPUTO) 18 September 2003 (2003-09-18) page 42; example 46a	1
X	FR 2 289 489 A (BAYER AG [DE]) 28 May 1976 (1976-05-28) page 12; example 17	1
X	EP 1 211 235 A (ADCHEMCO CORP [JP] JFE CHEMICAL CORP [JP]) 5 June 2002 (2002-06-05) page 8; example 8	1
	-/-	
<input checked="" type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents : *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance *E* earlier document 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 21 January 2008		Date of mailing of the international search report 28/01/2008
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax (+31-70) 340-3016		Authorized officer Jeanjean, Fabien

2

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/JP2007/069645

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 4 978 672 A (BOWMAN ROBERT M [US] ET AL) 18 December 1990 (1990-12-18) column 20, lines 3-5; example 3 -----	1
X	WO 2006/014012 A (OTSUKA PHARMA CO LTD [JP]; FUKUSHIMA TAE [JP]; MATSUMURA SHUJI [JP]; T) 9 February 2006 (2006-02-09) cited in the application page 675; example 582 page 726; example 1039 page 655; example 322 page 779; example 1049 page 716; example 940 page 864; example 2228 page 754; example 1202 -----	1-57

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/JP2007/069645

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 3182085	A	04-05-1965	BE 629102 A	
WO 03076406	A	18-09-2003	AU 2003205756 A1	22-09-2003
			BR 0308338 A	01-02-2005
			CA 2478652 A1	18-09-2003
			CN 1639126 A	13-07-2005
			EP 1483242 A1	08-12-2004
			FR 2836917 A1	12-09-2003
			JP 2005533002 T	04-11-2005
			MX PA04008721 A	06-12-2004
			US 2005154232 A1	14-07-2005
			UY 27716 A1	30-04-2003
			ZA 200408109 A	20-10-2005
FR 2289489	A	28-05-1976	BE 835036 A1	30-04-1976
			CH 618678 A5	15-08-1980
			DE 2452160 A1	06-05-1976
			GB 1494117 A	07-12-1977
			JP 51125243 A	01-11-1976
			NL 7512812 A	04-05-1976
EP 1211235	A	05-06-2002	NONE	
US 4978672	A	18-12-1990	NONE	
WO 2006014012	A	09-02-2006	AR 050448 A1	25-10-2006
			AU 2005268030 A1	09-02-2006
			BR PI0514150 A	27-11-2007
			CA 2573223 A1	09-02-2006
			EP 1773797 A2	18-04-2007
			KR 20070103351 A	23-10-2007
			US 2007270422 A1	22-11-2007

フロントページの続き

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード(参考)
A 6 1 P 31/04 (2006.01)	A 6 1 P 31/04	
A 6 1 P 25/00 (2006.01)	A 6 1 P 25/00	
A 6 1 P 35/00 (2006.01)	A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 17/06 (2006.01)	A 6 1 P 17/06	
A 6 1 P 37/08 (2006.01)	A 6 1 P 37/08	
A 6 1 P 5/06 (2006.01)	A 6 1 P 5/06	
C 0 7 D 317/58 (2006.01)	C 0 7 D 317/58	
C 0 7 D 405/14 (2006.01)	C 0 7 D 405/14	

(81) 指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), EP(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, 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, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW

- (74) 代理人 100140556
弁理士 新村 守男
- (74) 代理人 100114719
弁理士 金森 久司
- (74) 代理人 100143258
弁理士 長瀬 裕子
- (74) 代理人 100124969
弁理士 井上 洋一
- (72) 発明者 関口 和生
滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
- (72) 発明者 鈴木 敬
滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
- (72) 発明者 大淵 豊
滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
- (72) 発明者 奥野 貢広
滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
- (72) 発明者 大井 直人
滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
- (72) 発明者 大西 健司
滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
- (72) 発明者 本山 晶章
滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
- (72) 発明者 吉田 憲司
滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
- (72) 発明者 児玉 健志
滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
- (72) 発明者 杉山 和久
滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
- (72) 発明者 赤松 聖司
滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
- (72) 発明者 清野 邦彦

- 滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
 (72)発明者 柳原 康夫
 滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
 (72)発明者 渡邊 隆司
 滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
 (72)発明者 林 一彦
 滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
 (72)発明者 田中 英男
 滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内
 (72)発明者 住田 卓美
 滋賀県大津市唐崎 1 - 1 1 - 1 大塚製薬株式会社内

Fターム(参考) 4C022 CA01

4C063 AA01 AA03 BB07 BB09 CC81 DD10 DD12 EE01

4C086 AA01 AA02 BC50 GA02 GA07 GA12 MA01 MA04 NA14 ZA02

ZA89 ZB08 ZB13 ZB26 ZB35 ZC04 ZC20 ZC35

【要約の続き】

は1又は2を、R⁴はイミダゾリル低級アルキル基等を示す。]で表される芳香族化合物又はその塩を有効成分として含有するSTAT3/5活性化阻害剤を提供する。