

(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2009-534355  
(P2009-534355A)

(43) 公表日 平成21年9月24日(2009.9.24)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
<b>C07D 213/76</b> (2006.01)	C O 7 D 213/76 C S P	4 C O 5 5
<b>A61P 43/00</b> (2006.01)	A 6 1 P 43/00 1 1 1	4 C O 8 4
<b>A61P 25/00</b> (2006.01)	A 6 1 P 25/00	4 C O 8 6
<b>A61P 25/28</b> (2006.01)	A 6 1 P 25/28	
<b>A61P 25/18</b> (2006.01)	A 6 1 P 25/18	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 248 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2009-505888 (P2009-505888)  
 (86) (22) 出願日 平成19年4月18日 (2007.4.18)  
 (85) 翻訳文提出日 平成20年12月11日 (2008.12.11)  
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2007/053808  
 (87) 国際公開番号 W02007/118900  
 (87) 国際公開日 平成19年10月25日 (2007.10.25)  
 (31) 優先権主張番号 60/793,047  
 (32) 優先日 平成18年4月19日 (2006.4.19)  
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

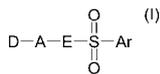
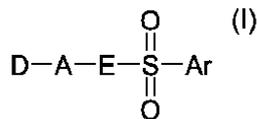
(71) 出願人 502104228  
 アボット ゲーエムペーハー ウント カ  
 ンパニー カーゲー  
 ドイツ連邦共和国 65205 ヴィース  
 バーデン、マックスブランクーリング  
 2  
 (74) 代理人 100062007  
 弁理士 川口 義雄  
 (74) 代理人 100114188  
 弁理士 小野 誠  
 (74) 代理人 100140523  
 弁理士 渡邊 千尋  
 (74) 代理人 100119253  
 弁理士 金山 賢教

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 セロトニン5HT<sub>6</sub>受容体の調節に応答する障害を治療するために好適な複素環化合物

(57) 【要約】

本発明は、可変要素が特許請求の範囲および説明で示した意味を有する式 (I) の化合物に関するものである。本発明はさらに、5HT<sub>6</sub>受容体リガンドによる治療に感受性である医学的障害の治療のための医薬品を製造する上での式 (I) の化合物またはその製薬上許容される塩の使用に関するものでもある。

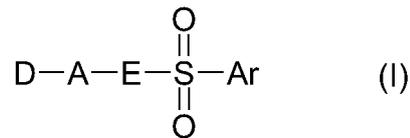


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式 I の化合物

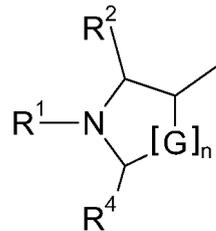
【化 1】



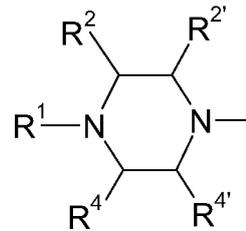
[ 式中、

D は、下記式 B または C :

【化 2】



B



C

10

20

30

40

50

の基であり；

n は 0、1 または 2 であり；

G は CH<sub>2</sub> または CHR<sup>3</sup> であり；

R<sup>1</sup> は、H、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキルによって置換された C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ヒドロキシアルキル、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、フッ素化 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、フッ素化 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、ホルミル、アセチル、プロピオニルまたはベンジルであり；

R<sup>2</sup>、R<sup>2'</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> および R<sup>4'</sup> は互いに独立に、H、メチル、フルオロメチル、ジ-フルオロメチル、またはトリフルオロメチルであり；

A は、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルおよびフッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシから選択される 1、2 もしくは 3 個の置換基によって場合により置換されている 2, 4-ピリジレン、3, 5-ピリジレンまたは 2, 6-ピリジレンであり；

E は NR<sup>7</sup> または CH<sub>2</sub> であり、R<sup>7</sup> は H または C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-アルキルであり；

Ar は、フェニル、環員として N、O および S から選択される 1、2 もしくは 3 個のヘテロ原子を含む 5 もしくは 6 員のヘテロ芳香族基および飽和もしくは不飽和 5 員もしくは 6 員の炭素環または複素環に縮合したフェニル環からなる群から選択される環状基であり、前記複素環は環員として N、O および S から選択される 1、2 もしくは 3 個のヘテロ原子および / またはそれぞれ独立に NR<sup>8</sup> から選択される 1、2 もしくは 3 個のヘテロ原子含有基を含み、R<sup>8</sup> は H、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルカルボニルまたはフッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルカルボニルであり、ならびに前記環状基 Ar は 1、2 もしくは 3 個の置換基 R<sup>a</sup> を有することができ；

各 R<sup>a</sup> は独立に、ハロゲン、ヒドロキシル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ヒドロキシアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、フッ素化 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、フッ素化 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>

- C<sub>6</sub> - ヒドロキシアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルチオ、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、フェニルスルホニル、ピリジルスルホニル、ベンジルオキシ、フェノキシ、フェニル（最後に言及した5個の基におけるフェニルおよびピリジル基は非置換であることができ、または C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルおよびハロゲンから選択される1から3個の置換基を有していることができる。））、CN、ニトロ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニルアミノ、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニルアミノ、カルボキシ、NH - C (O) - NR<sup>6</sup> R<sup>7</sup>、NR<sup>6</sup> R<sup>7</sup>、NR<sup>6</sup> R<sup>7</sup> - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキレン、O - NR<sup>6</sup> R<sup>7</sup> (R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> は互いに独立に、H、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルまたは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシであり、または N と一体となって、4、5員もしくは6員の飽和または不飽和環を形成していても良い。)、R<sup>10</sup> - CO - NR<sup>6</sup> - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキレン (R<sup>6</sup> は上記で定義の通りであり、および R<sup>10</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルまたはフェニルであり、フェニル基は非置換であって良く、または C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルおよびハロゲンから選択される1から3個の置換基を有することができる。)、CH<sub>2</sub> - ピリジル (ピリジル基は非置換であって良く、または C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルおよびハロゲンから選択される1から3個の置換基を有していても良い。) であり、または環員として N、O および S から選択される1、2、3もしくは4個のヘテロ原子および/または NR<sup>9</sup> (R<sup>9</sup> は R<sup>8</sup> について示した意味のいずれかを有する。)、SO、SO<sub>2</sub> および CO から選択される1、2もしくは3個のヘテロ原子含有基を含む飽和もしくは不飽和の芳香族もしくは非芳香族3から7員複素環であり、および前記複素環はヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルチオ、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルチオ、NR<sup>6</sup> R<sup>7</sup> - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキレン (R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> は上記で定義の通りである。)、カルボキシおよび C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシカルボニルから選択される1、2もしくは3個の置換基を有することができる。]

および該化合物の生理的に耐容される酸付加塩。

【請求項2】

R<sup>1</sup> が、H、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルによって置換された C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ヒドロキシアルキル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フッ素化 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、フッ素化 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、ホルミル、アセチルまたはプロピオニルであり；ならびに

R<sup>a</sup> が、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ヒドロキシアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、フッ素化 C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> - アルケニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フッ素化 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - ヒドロキシアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルチオ、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルスルホニル、フェニルスルホニル、ベンジルオキシ、フェノキシ（最後に言及した3個の基におけるフェニル基は非置換であることができ、または C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルおよびハロゲンから選択される1から3個の置換基を有することができる。）、CN、ニトロ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニルアミノ、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルカルボニルアミノ、カルボキシ、NH - C (O) - NR<sup>6</sup> R<sup>7</sup>、NR<sup>6</sup> R<sup>7</sup>、NR<sup>6</sup> R<sup>7</sup> - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキレン、O -

10

20

30

40

50

$\text{NR}^6\text{R}^7$  ( $\text{R}^6$  および  $\text{R}^7$  は互いに独立に、 $\text{H}$ 、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルキル、フッ素化  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルキルまたは  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルコキシであり、または  $\text{N}$  と一体となって 4 員、5 員もしくは 6 員の飽和もしくは不飽和環を形成していても良い。) であり、または環員として  $\text{N}$ 、 $\text{O}$  および  $\text{S}$  から選択される 1、2、3 もしくは 4 個のヘテロ原子および / または  $\text{NR}^9$  ( $\text{R}^9$  は  $\text{R}^8$  について示した意味のいずれかを有する。)、 $\text{SO}$ 、 $\text{SO}_2$  および  $\text{CO}$  から選択される 1、2 もしくは 3 個のヘテロ原子含有基を含む飽和もしくは不飽和の 3 から 7 員複素環であり、および前記複素環はヒドロキシ、ハロゲン、 $\text{C}_1 - \text{C}_6$  - アルキル、フッ素化  $\text{C}_1 - \text{C}_6$  - アルキルおよび  $\text{C}_1 - \text{C}_6$  - アルコキシから選択される 1、2 もしくは 3 個の置換基を有することができる

請求項 1 に記載の化合物。

10

【請求項 3】

$n$  が 0 または 1 である請求項 1 または 2 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 4】

$\text{R}^1$  が、水素、メチル、エチル、 $n$  - プロピル、2 - フルオロエチル、3 - フルオロプロピル、3 - ヒドロキシプロピル、シクロプロピルメチルまたはアリルである請求項 1 から 3 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 5】

$\text{R}^1$  が  $n$  - プロピルまたはアリルである請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

$\text{R}^2$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$  および  $\text{R}^4$  が  $\text{H}$  である請求項 1 から 5 のいずれかに記載の化合物。

20

【請求項 7】

$\text{A}$  が、ハロゲン、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルコキシ、フッ素化  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルキルおよびフッ素化  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルコキシから選択される 1 以上の置換基によって置換されていても良い 2, 4 - ピリジレンまたは 3, 5 - ピリジレンである請求項 1 から 6 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 8】

$\text{A}$  がハロゲン、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルコキシ、フッ素化  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルキルおよびフッ素化  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルコキシから選択される 1 以上の置換基によって置換されていても良い 3, 5 - ピリジレンである請求項 7 に記載の化合物。

30

【請求項 9】

$\text{E}$  が  $\text{NH}$  である請求項 1 から 8 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 10】

$\text{Ar}$  が、請求項 1 で定義されたとおりの 1 個の基  $\text{R}^a$  および場合によりハロゲン、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルキル、フッ素化  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルコキシおよびフッ素化  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルコキシから独立に選択される 1 個もしくは 2 個の別の基を有する請求項 1 から 9 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 11】

$\text{Ar}$  が、請求項 1 または 9 で定義されたとおりに置換されていても良いフェニル、チエニル、ピリジル、ピリミジル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、トリアゾリル、チアジアゾリル、キノリニル、イソキノリニル、テトラヒドロイソキノリニル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフエニル、ベンゾオキサジニル、ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサジアゾリル、ベンゾチアジアゾリルまたはインダニルである請求項 1 から 10 のいずれかに記載の化合物。

40

【請求項 12】

$\text{Ar}$  が、請求項 1 で定義されたとおりの 1 個の基  $\text{R}^a$  および場合によりハロゲン、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルキル、フッ素化  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルキル、 $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルコキシおよびフッ素化  $\text{C}_1 - \text{C}_4$  - アルコキシから独立に選択される 1 個もしくは 2 個の別の基を有するフェニルである請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 13】

50

A<sub>r</sub>が、非置換であり、または請求項1でR<sup>a</sup>について定義されたとおりの1個の基R<sup>a</sup>および場合によりハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシおよびフッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシから独立に選択される1個もしくは2個の別の基R<sup>a</sup><sub>b</sub>を有するチエニルである請求項1から11のいずれかに記載の化合物。

【請求項14】

R<sup>a</sup>が、ハロゲン、ヒドロキシル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルスルホニル、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルスルホニル、フェニルスルホニル、ピリジルスルホニル、フェニル(最後に言及した3個の基におけるフェニル基およびピリジル基は非置換であることができ、またはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルおよびハロゲンから選択される1から3個の置換基を有していることができる。)、R<sup>10</sup>-CO-NR<sup>6</sup>-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-アルキレン、CH<sub>2</sub>-ピリジル(ピリジル基は非置換であることができ、またはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルおよびハロゲンから選択される1から3個の置換基を有することができる。)、および環員としてのN、OおよびSから選択される1、2もしくは3個のヘテロ原子および/またはNR<sup>9</sup>(R<sup>9</sup>はH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルカルボニルまたはフッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルカルボニルである。)から選択される1、2もしくは3個のヘテロ原子含有基を含む飽和、部分不飽和もしくは芳香族の5員もしくは6員複素環から選択され、および前記複素環はヒドロキシ、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルチオ、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルチオ、NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキレン、カルボキシルおよびC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシカルボニルから選択される、1、2もしくは3個の置換基を有していても良く、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>およびR<sup>10</sup>は請求項1で定義の通りである請求項13に記載の化合物。

10

20

【請求項15】

R<sup>a</sup>が、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルスルホニル、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルスルホニル、フェニルスルホニル(フェニル基は非置換であることができ、またはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルおよびハロゲンから選択される1から3個の置換基を有することができる。)、および環員として1個の窒素原子もしくは1個の基NR<sup>9</sup>(R<sup>9</sup>はHまたはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルである。)および場合によりN、O、Sから選択される1個もしくは2個の別のヘテロ原子を含む5員もしくは6員のヘテロ芳香族環から選択され、および前記ヘテロ芳香族環はハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルチオおよびフッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルチオから選択される1、2もしくは3個の置換基を有していても良い請求項14に記載の化合物。

30

【請求項16】

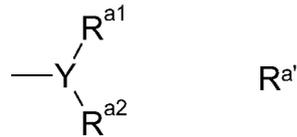
A<sub>r</sub>が、非置換であり、または請求項1でR<sup>a</sup>について定義されたとおりの1個の基R<sup>a</sup>および場合によりハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシおよびフッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシから独立に選択される1個もしくは2個の別の基R<sup>a</sup><sub>b</sub>を有するベンゾチエニルである請求項1から11のいずれかに記載の化合物。

40

【請求項17】

A<sub>r</sub>が、下記式R<sup>a</sup>の1個の基R<sup>a</sup>を有する請求項1から16のいずれかに記載の化合物

## 【化 3】



[ 式中、

Y は、N、CH または CF であり；

R<sup>a1</sup> および R<sup>a2</sup> は互いに独立に、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-アルキル および C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-アルコキシ (alkxy) から選択され、ただし Y が CH または CF である場合、基 R<sup>a1</sup> または R<sup>a2</sup> のうちの一方は水素またはフッ素であることもでき、あるいは

10

R<sup>a1</sup> および R<sup>a2</sup> が一体となって基 (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> を形成し、水素原子のうちの 1 個もしくは 2 個がフッ素、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-アルキル または C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-アルコキシによって置き換わっていても良く、1 個の CH<sub>2</sub> 部分が O、S、SO、SO<sub>2</sub> または NR<sup>c</sup> によって置き換わっていても良く、R<sup>c</sup> は H または C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-アルキルであり、および m は 2、3、4、5 または 6 である。]

## 【請求項 18】

前記 R<sup>a</sup> が、イソプロピル、(R)-1-フルオロエチル、(S)-1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、1,1-ジフルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、(R)-1-フルオロプロピル、(S)-1-フルオロプロピル、2-フルオロプロピル、3-フルオロプロピル、1,1-ジフルオロプロピル、2,2-ジフルオロプロピル、3,3-ジフルオロプロピル、3,3,3-トリフルオロプロピル、シクロプロピル、シクロブチル、1-フルオロシクロプロピル、2-フルオロシクロプロピル、(S)-2,2-ジフルオロシクロプロピル および (R)-2,2-ジフルオロシクロプロピル から選択される請求項 17 に記載の化合物。

20

## 【請求項 19】

前記基 R<sup>a</sup> が 1、2、3 もしくは 4 個のフッ素原子を有する請求項 17 または 18 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 20】

Ar が、フェニル環の 3 位もしくは 4 位に基 R<sup>a</sup> を有するフェニルである請求項 1 から 19 のいずれかに記載の化合物。

30

## 【請求項 21】

基 A を有する炭素原子における絶対立体配置が (S) である請求項 1 から 20 のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項 22】

3 から 7 員の複素環 R<sup>a</sup> が、アゼチジニル、ピロリジニル、オキソピロリジニル、オキソ-オキサゾリジニル、ペペリジニル、ペペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、1-オキソチオモルホリニル、1,1-ジオキソチオモルホリニル、ピロリル、フラニル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、フラザニル、チアジアゾリル および テトラゾリル から選択され、前記複素環基が非置換であることができ、またはハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ および ヒドロキシ から選択される 1 から 3 個の置換基を有することができる請求項 1 から 21 のいずれかに記載の化合物。

40

## 【請求項 23】

3 から 7 員の複素環 R<sup>a</sup> が、アゼチジニル、ピロリジニル、オキソピロリジニル、オキソ-オキサゾリジニル、ペペリジニル、モルホリニル、フラニル、チエニル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル および チアジアゾリル から選択され、前記複素環基が非置換であることができ、またはハロゲン および C<sub>1</sub>-C

50

4 - アルキルから選択される 1 から 3 個の置換基を有することができる請求項 2 2 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

$R^a$  が、基  $R^a$ 、 $C_1 - C_4$ -アルコキシおよびフッ素化  $C_1 - C_4$ -アルコキシから選択される請求項 1 から 2 3 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 2 5】

場合により少なくとも 1 種類の生理的に許容される担体または補助物質と一緒に、少なくとも 1 種類の請求項 1 から 2 4 のいずれかに記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 2 6】

有効量の少なくとも 1 種類の請求項 1 から 2 4 のいずれかに記載の化合物を、処置を必要とする対象者に投与する段階を有する、5HT<sub>6</sub>受容体リガンドによる治療に感受性の医学的障害の治療方法。

10

【請求項 2 7】

医学的障害が、中枢神経系の疾患である請求項 2 6 に記載の方法。

【請求項 2 8】

認知機能障害を治療するための請求項 2 7 に記載の方法。

【請求項 2 9】

アルツハイマー病および統合失調症に関連する認知機能障害を治療するための請求項 2 8 に記載の方法。

【請求項 3 0】

5HT<sub>6</sub>受容体リガンドによる治療に感受性である医学的障害の治療のための医薬組成物を製造する上での、請求項 1 から 2 4 のいずれかに記載の化合物の使用。

20

【請求項 3 1】

医学的障害が、中枢神経系の疾患である請求項 3 0 に記載の使用。

【請求項 3 2】

認知機能障害を治療するための請求項 3 1 に記載の使用。

【請求項 3 3】

アルツハイマー病および統合失調症に関連する認知機能障害を治療するための請求項 3 2 に記載の使用。

【請求項 3 4】

D<sub>3</sub>ドーパミン受容体に対してアフィニティを有する少なくとも一つの化合物および 5HT<sub>6</sub>受容体に対するアフィニティを有する少なくとも一つの化合物および場合により少なくとも一つの生理的に許容される担体および/または補助物質を含む医薬組成物であって、前記 5HT<sub>6</sub>受容体に対するアフィニティを有する化合物が請求項 1 から 2 4 のいずれかで定義のものである医薬組成物。

30

【請求項 3 5】

中枢神経系の疾患の治療のための医薬品を製造する上での 5HT<sub>6</sub>受容体に対してアフィニティを有する少なくとも一つの化合物と組み合わせた D<sub>3</sub>ドーパミン受容体に対してアフィニティを有する少なくとも一つの化合物のまたは請求項 3 3 で定義の医薬組成物の使用であって、前記 5HT<sub>6</sub>受容体に対するアフィニティを有する化合物が請求項 1 から 2 4 のいずれかで定義のものである使用。

40

【請求項 3 6】

D<sub>3</sub>ドーパミン受容体に対してアフィニティを有する化合物が、多くとも 150 nM のドーパミン D<sub>3</sub>受容体に対する結合定数  $K_i$  を有し、ならびに 5HT<sub>6</sub>受容体に対してアフィニティを有する化合物が、多くとも 150 nM の 5HT<sub>6</sub>受容体に対する結合定数  $K_i$  を有する請求項 3 4 および 3 5 に記載の組成物または使用。

【請求項 3 7】

認知機能障害を治療するための請求項 3 5 または 3 6 のいずれかに記載の使用。

【請求項 3 8】

アルツハイマー病および統合失調症に関連する認知機能障害を治療するための請求項 3

50

7に記載の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規な複素環化合物に関する。その化合物は貴重な治療特性を有し、特にセロトニン<sub>5</sub>-HT<sub>6</sub>受容体の調節に応答する疾患の治療において好適である。

【背景技術】

【0002】

モノアミン系の神経伝達物質および局所ホルモンであるセロトニン(5-ヒドロキシトリプタミン、5HT)は、トリプトファンのヒドロキシル化および脱炭酸によって形成される。その最大濃度は、消化管の腸クロム親和性細胞で認められ、残りのものは血小板および中枢神経系(CNS)に主として存在する。5HTは、非常に多くの生理的経路および病態生理学的経路において示唆されている。末梢では、それは多くの平滑筋と接触し、内皮依存性血管拡張を誘発する。CNSでは、それは、食欲、気分、不安、幻覚、睡眠、嘔吐および疼痛知覚の制御などの非常に多様な機能に参与するものと考えられている。

【0003】

5HTを分泌するニューロンは、セロトニン作働性と称される。5HTの機能は、特異的(セロトニン作働性)ニューロンとの相互作用で発揮される。現在までのところ、5HT<sub>1</sub>(サブタイプ5HT<sub>1A</sub>、5HT<sub>1B</sub>、5HT<sub>1D</sub>、5HT<sub>1E</sub>および5HT<sub>1F</sub>を有する)、5HT<sub>2</sub>(サブタイプ5HT<sub>2A</sub>、5HT<sub>2B</sub>および5HT<sub>2C</sub>を有する)、5HT<sub>3</sub>、5HT<sub>4</sub>、5HT<sub>5</sub>(サブタイプ5HT<sub>5A</sub>および5HT<sub>5B</sub>を有する)、5HT<sub>6</sub>および5HT<sub>7</sub>という7種類の5HT受容体が確認されている。これら受容体のほとんどが、アデニル酸シクラーゼまたはホスホリパーゼCのいずれかの活性に影響を与えるGタンパク質にカップリングしている。

【0004】

ヒト5HT<sub>6</sub>受容体は、アデニル酸シクラーゼに強くカップリングしている。それらは、脳の辺縁領域、線条体および皮質領域全体に分布しており、抗精神病薬に対して高いアフィニティを示す。

【0005】

好適な物質による5HT<sub>6</sub>受容体の調節は、記憶、認識および学習における欠陥などの認知機能障害、特にアルツハイマー病、加齢性認識衰退および軽度認知障害に関連したものの、注意力欠如障害/多動性症候群、人格障害(統合失調症など)、特に統合失調症関連の認知障害、抑鬱、不安および強迫性障害などの情動障害、パーキンソン病および癲癇などの動作または運動障害、片頭痛、睡眠障害(概日リズムの障害など)、食欲不振および過食症などの摂食障害、過敏性大腸症候群などのある種の消化管障害、卒中などの神経変性関連の疾患、脊髄または頭部の外傷および水頭症などの頭部損傷、薬物嗜癖および肥満などのある種の障害を改善することが期待される。

【0006】

CNSに関する示唆がある別の神経伝達物質はドーパミンである。ドーパミン作働性伝達物質系における障害は、中枢神経系の疾患を生じ、それには例えば統合失調症、抑鬱およびパーキンソン病などがある。これらの疾患および他のものは、ドーパミン受容体と相互作用する薬剤で治療される。

【0007】

ドーパミン受容体は2つのファミリーに分けられる。一方で、D<sub>2</sub>、D<sub>3</sub>およびD<sub>4</sub>受容体からなるD<sub>2</sub>群があり、他方ではD<sub>1</sub>およびD<sub>5</sub>受容体からなるD<sub>1</sub>群がある。D<sub>1</sub>およびD<sub>2</sub>受容体は広く分布しているが、D<sub>3</sub>受容体は位置選択的に発現されるように思われる。従って、これらの受容体は、辺縁系および中脳辺縁ドーパミン系の突起領域、特に中隔側坐核において優先的に認められるが、扁桃体などの他の領域でも認められる。この比較的位置選択的な発現のため、D<sub>3</sub>受容体はほとんど副作用を持たない標的と見なされており、選択的D<sub>3</sub>リガンドは公知の抗精神病薬の特性を有するが、それらのドーパ

10

20

30

40

50

ミンD<sub>2</sub>受容体介在による神経系の副作用がないであろうと仮定されている(P. Sokoloff et al., Localization and Function of the D<sub>3</sub> Dopamine Receptor, Arzneim. Forsch./Drug Res. 42(1), 224 (1992); P. Sokoloff et al. Molecular Cloning and Characterization of a Novel Dopamine Receptor (D<sub>3</sub>) as a Target for Neuroleptics, Nature, 347, 146 (1990))。

【0008】

ドーパミンD<sub>3</sub>受容体に対するアフィニティを有する化合物が、多様な場合に関して先行技術で報告されており、例えばWO95/04713、WO96/23760、WO97/45503、WO99/58499に、そして未公開の国際特許出願PCT/EP2005/011106にある。

10

【0009】

5HT<sub>6</sub>受容体に対してアフィニティを有する化合物も、先行技術で報告されており、例えばWO2005/037830、WO2005/026125、WO00/05225およびWO98/27081にある。しかしながら、5HT<sub>6</sub>受容体に対するそれらのアフィニティおよび選択性またはそれらの薬理プロファイルは、まだ満足できるものではない。

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0010】

本発明の目的は、5HT<sub>6</sub>受容体に対する高いアフィニティおよび選択性を有し、場合によりドーパミンD<sub>3</sub>受容体に対して高いアフィニティおよび選択性(特に、D<sub>2</sub>に対して)を有することで、5HT<sub>6</sub>受容体に関連するかそれによって影響を受ける障害の治療を可能とする化合物を提供することにある。両方の受容体に対するアフィニティを有する化合物は、5HT<sub>6</sub>受容体およびD<sub>3</sub>受容体の両方に関連するかそれによって影響を受ける障害を治療する上で好適であることで、個々の障害の複数の側面の治療を可能とするものと予想される。

20

【0011】

前記化合物はさらに、良好な薬理プロファイル、例えば良好な脳血漿比、良好な生物学的利用能、良好な代謝安定性またはミトコンドリア呼吸阻害の低さをも有するべきである。

30

【課題を解決するための手段】

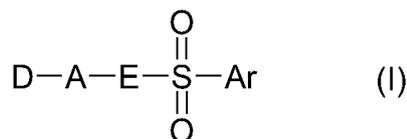
【0012】

(発明の概要)

本発明は、5HT<sub>6</sub>受容体リガンドとして作用する化合物を提供するという目的に基づいたものである。この目的は、下記式Iの化合物およびその生理的に耐容される酸付加塩によって達成される。

【0013】

【化4】



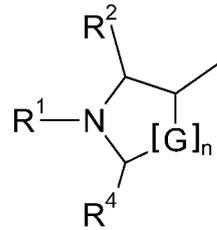
40

式中、

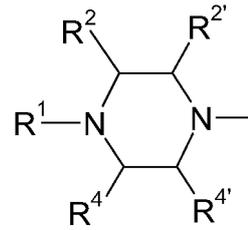
Dは、下記式BまたはC：

【0014】

## 【化5】



B



C

10

の基であり；

n は 0、1 または 2 であり；

G は CH<sub>2</sub> または CHR<sup>3</sup> であり；

R<sup>1</sup> は、H、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキルによって置換された C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ヒドロキシアルキル、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、フッ素化 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、フッ素化 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、ホルミル、アセチル、プロピオニルまたはベンジルであり；

R<sup>2</sup>、R<sup>2'</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> および R<sup>4'</sup> は互いに独立に、H、メチル、フルオロメチル、ジ-フルオロメチル、またはトリフルオロメチルであり；

A は、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルおよびフッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシから選択される 1、2 もしくは 3 個の置換基によって場合により置換されている 2, 4-ピリジレン、3, 5-ピリジレンまたは 2, 6-ピリジレンであり；

E は NR<sup>5</sup> または CH<sub>2</sub> であり、R<sup>5</sup> は H または C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-アルキルであり；

Ar は、フェニル、環員として N、O および S から選択される 1、2 もしくは 3 個のヘテロ原子を含む 5 もしくは 6 員のヘテロ芳香族基および飽和もしくは不飽和 5 員もしくは 6 員の炭素環または複素環に縮合したフェニル環からなる群から選択される環状基であり、前記複素環は環員として N、O および S から選択される 1、2 もしくは 3 個のヘテロ原子および / またはそれぞれ独立に NR<sup>8</sup> から選択される 1、2 もしくは 3 個のヘテロ原子含有基を含み、R<sup>8</sup> は H、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルカルボニルまたはフッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルカルボニルであり、前記環状基 Ar は 1、2 もしくは 3 個の置換基 R<sup>a</sup> を有することができ；

各 R<sup>a</sup> は独立に、ハロゲン、ヒドロキシル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ヒドロキシアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、フッ素化 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、フッ素化 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ヒドロキシアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルチオ、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルフィニル、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルホニル、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルスルホニル、フェニルスルホニル、ピリジルスルホニル、ベンジルオキシ、フェノキシ、フェニル（最後に言及した 5 個の基におけるフェニルおよびピリジル基は非置換であることができ、または C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルおよびハロゲンから選択される 1 から 3 個の置換基を有していることができる。）、CN、ニトロ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルカルボニル、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルカルボニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルカルボニルアミノ、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキルカルボニルアミノ、カルボキシ、NH-C(O)-NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキレン、O-NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>（R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> は互いに独立に、H、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ア

20

30

40

50

ルキルまたは  $C_1 - C_4$  - アルコキシであり、または  $N$  と一体となって、4、5員もしくは6員の飽和または不飽和環を形成していても良い。) 、  $R^{10} - CO - NR^6 - C_1 - C_6$  - アルキレン ( $R^6$  は上記で定義の通りであり、 $R^{10}$  は  $C_1 - C_4$  - アルキルまたはフェニルであり、フェニル基は非置換であっても良く、または  $C_1 - C_4$  - アルキル、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキルおよびハロゲンから選択される1から3個の置換基を有することができる。) 、  $CH_2$  - ピリジル (ピリジル基は非置換であっても良く、または  $C_1 - C_4$  - アルキル、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキルおよびハロゲンから選択される1から3個の置換基を有していても良い。) であり、または環員として  $N$ 、 $O$  および  $S$  から選択される1、2、3もしくは4個のヘテロ原子および/または  $NR^9$  ( $R^9$  は  $R^8$  について示した意味のいずれかを有する。) 、  $SO$ 、 $SO_2$  および  $CO$  から選択される1、2もしくは3個のヘテロ原子含有基を含む飽和もしくは不飽和の芳香族もしくは非芳香族3から7員複素環であり、前記複素環はヒドロキシ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - アルキルチオ、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルキルチオ、 $NR^6 R^7 - C_1 - C_6$  - アルキレン ( $R^6$  および  $R^7$  は上記で定義の通りである。) 、カルボキシルおよび  $C_1 - C_4$  - アルコキシカルボニルから選択される1、2もしくは3個の置換基を有することができる。

10

## 【0015】

従って本発明は、一般式 I の化合物およびそれらの生理的に耐容される酸付加塩に関するものである。

20

## 【0016】

化合物 I の具体的な実施形態において、

$R^1$  は、 $H$ 、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキルによって置換された  $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ヒドロキシアルキル、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、フッ素化  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$  - アルケニル、フッ素化  $C_3 - C_6$  - アルケニル、ホルミル、アセチルまたはプロピオニルであり；

$R^a$  は、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ -  $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、フッ素化  $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、フッ素化  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - ヒドロキシアルコキシ、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ -  $C_1 - C_6$  - アルコキシ、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - アルキルチオ、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルフィニル、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル、フェニルスルホニル、ベンジルオキシ、フェノキシ (最後に言及した3個の基におけるフェニル基は非置換であることができ、または  $C_1 - C_4$  - アルキル、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキルおよびハロゲンから選択される1から3個の置換基を有することができる。) 、 $CN$ 、ニトロ、 $C_1 - C_6$  - アルキルカルボニル、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルカルボニルアミノ、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルキルカルボニルアミノ、カルボキシ、 $NH - C(O) - NR^6 R^7$ 、 $NR^6 R^7$ 、 $NR^6 R^7 - C_1 - C_6$  - アルキレン、 $O - NR^6 R^7$  ( $R^6$  および  $R^7$  は互いに独立に、 $H$ 、 $C_1 - C_4$  - アルキル、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキルまたは  $C_1 - C_4$  - アルコキシであり、または  $N$  と一体となって4員、5員もしくは6員の飽和もしくは不飽和環を形成していても良い。) であり、または環員として  $N$ 、 $O$  および  $S$  から選択される1、2、3もしくは4個のヘテロ原子および/または  $NR^9$  ( $R^9$  は  $R^8$  について示した意味のいずれかを有する。) 、 $SO$ 、 $SO_2$  および  $CO$  から選択される1、2もしくは3個のヘテロ原子含有基を含む飽和もしくは不飽和の3から7員複素環であり、前記複素環はヒドロキシ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルキルおよび  $C_1 - C_6$  - アルコキシから選択される1、2もしくは3個の置換基を有することができる。

30

40

50

## 【0017】

本発明はさらに、適切であれば生理的に許容される担体および/または補助物質とともに、少なくとも一つの式Iの化合物および/または少なくとも一つのIの生理的に耐容される酸付加塩を含む医薬組成物に関するものでもある。

## 【0018】

本発明はさらに、有効量の少なくとも一つの式Iの化合物および/または少なくとも一つのIの生理的に耐容される酸付加塩を処置を必要とする対象者に対して投与する段階を有する、5HT<sub>6</sub>受容体拮抗薬または5HT<sub>6</sub>作動薬による影響に応答する障害の治療方法に関するものでもある。

## 【0019】

本発明はさらに、5-HT<sub>6</sub>受容体リガンドによる治療に感受性の医学的障害の治療のための医薬品の製造における、式Iの化合物および/またはその生理的に耐容される酸付加塩の使用に関するものでもある。

## 【0020】

(発明の詳細な記述)

本発明の好ましい態様、例えば化合物Iの可変要素の好ましい意味、好ましい化合物Iおよび本発明による方法もしくは使用の好ましい実施形態に関して下記で行う記述は、各場合で、それら自体またはそれらの組み合わせに当てはまるものである。

## 【0021】

5HT<sub>6</sub>受容体の拮抗薬または作動薬の影響に応答する疾患には、特に中枢神経系における障害および疾患、特に記憶、認識および学習における欠陥などの認知機能障害、特にアルツハイマー病、加齢性認識衰退および軽度認知障害に関連したもの、注意力欠如障害/多動性症候群、人格障害(統合失調症など)、特に統合失調症関連の認知障害、抑鬱、双極性障害、不安および強迫性障害などの情動障害、パーキンソン病および癲癇などの動作または運動障害、片頭痛、睡眠障害(概日リズムの障害など)、食欲不振および過食症などの摂食障害、過敏性大腸症候群などのある種の消化管障害、卒中などの神経変性関連の疾患、脊髄または頭部の外傷および水頭症などの頭部損傷、薬物嗜癖および肥満などがある。

## 【0022】

本発明によれば、少なくとも1種類の最初に言及した意味を有する一般式Iの化合物を上記の適応症の治療に用いる。ある構成の式Iの化合物が異なる空間配置で存在し得る場合、例えばそれらが1以上の不斉中心、多置換環もしくは二重結合を有する場合、または異なる互変異体として存在し得る場合、エナンチオマーの混合物、特にラセミ体、ジアステレオマーの混合物、互変異体の混合物を用いることも可能であるが、好ましくは個々の実質的に純粋な式Iの化合物および/またはその塩のエナンチオマー、ジアステレオマーおよび互変異体である。

## 【0023】

特に、基Aを有する窒素含有環Dの炭素原子は、(S)または(R)配置を有することができる。しかしながら(S)配置が好ましい。

## 【0024】

さらに、基Aは置換基R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>またはR<sup>4</sup>(それらのうちの少なくとも1個が水素ではない場合)のいずれかに対してシスまたはトランス位置にあることができる。しかしながら、シス位置が好ましい。

## 【0025】

式Iの化合物の生理的に許容される塩、特に生理的に耐容される酸との酸付加塩を用いることも同様に可能である。好適な生理的に耐容される有機および無機酸の例には、塩酸、臭化水素酸塩、リン酸、硫酸、メタンスルホン酸などのC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルスルホン酸、ベンゼンスルホン酸およびトルエンスルホン酸などの芳香族スルホン酸、シュウ酸、マレイン酸、フマル酸、乳酸、酒石酸、アジピン酸および安息香酸がある。使用可能な他の酸が、文献に記載されている(Fortschritte der Arzneimittelforschung [Advances

10

20

30

40

50

in drug research], Volume 10, pages 224ff., Birkhauser Verlag, Basle and Stuttgart, 1966)。

【0026】

可変要素の上記定義で言及した有機部分は、ハロゲンという用語のように、個々の基の構成員についての個別の列記に関しての総称である。接頭語の  $C_n - C_m$  は各場合で、その基における炭素原子の可能な数を示す。

【0027】

ハロゲンという用語は各場合で、フッ素、臭素、塩素またはヨウ素を指し、特にフッ素または塩素を指す。

【0028】

$C_1 - C_4$  アルキルは、1 - 4 個の炭素原子を有する直鎖または分岐のアルキル基である。アルキル基の例には、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、2-ブチル、イソ-ブチルまたは *tert*-ブチルがある。 $C_1 - C_2$  アルキルはメチルもしくはエチルであり、 $C_1 - C_3$  アルキルはさらに *n*-プロピルまたはイソプロピルである。

10

【0029】

$C_1 - C_6$  アルキルは、1 - 6 個の炭素原子を有する直鎖または分岐のアルキル基である。例には、上記の  $C_1 - C_4$  アルキルならびにペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ヘキシル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピルおよび1-エチル-2-メチルプロピルなどがある。

20

【0030】

フッ素化  $C_1 - C_6$  アルキルは、1 - 6 個、特に1 - 4 個の炭素原子 (= フッ素化  $C_1 - C_4$  アルキル)、特に1 - 3 個の炭素原子 (= フッ素化  $C_1 - C_3$  アルキル) を有する直鎖または分岐アルキル基であって、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、(R)-1-フルオロエチル、(S)-1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、1,1-ジフルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、1,1,2,2-テトラフルオロエチル、(R)-1-フルオロプロピル、(S)-1-フルオロプロピル、2-フルオロプロピル、3-フルオロプロピル、1,1-ジフルオロプロピル、2,2-ジフルオロプロピル、3,3-ジフルオロプロピル、3,3,3-トリフルオロプロピル、(R)-2-フルオロ-1-メチルエチル、(S)-2-フルオロ-1-メチルエチル、(R)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル、(S)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル、(R)-1,2-ジフルオロ-1-メチルエチル、(S)-1,2-ジフルオロ-1-メチルエチル、(R)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル、(S)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル、2-フルオロ-1-(フルオロメチル)エチル、1-(ジフルオロメチル)-2,2-ジフルオロエチル、1-(トリフルオロメチル)-2,2,2-トリフルオロエチル、1-(トリフルオロメチル)-1,2,2,2-テトラフルオロエチル、(R)-1-フルオロブチル、(S)-1-フルオロブチル、2-フルオロブチル、3-フルオロブチル、4-フルオロブチル、1,1-ジフルオロブチル、2,2-ジフルオロブチル、3,3-ジフルオロブチル、4,4-ジフルオロブチル、4,4,4-トリフルオロブチルなどにおけるように、少なくとも1個、例えば1個、2個、3個、4個または全ての水素原子がフッ素原子によって置き換わっているものである。

30

40

【0031】

分岐  $C_3 - C_6$  アルキルは、少なくとも1個が2級もしくは3級炭素原子である3 - 6 個の炭素原子を有するアルキルである。例には、イソプロピル、*tert*-ブチル、2-

50

ブチル、イソブチル、2 - ペンチル、2 - ヘキシル、3 - メチルペンチル、1, 1 - ジメチルブチル、1, 2 - ジメチルブチル 1 - メチル - 1 - エチルプロピルがある。

【0032】

フッ素化分岐  $C_3 - C_6$  アルキルは、少なくとも1個、例えば1, 2, 3, 4もしくはは全ての水素原子がフッ素原子によって置き換わっている少なくとも1個が2級もしくはは3級炭素原子である3から6個の炭素原子を有するアルキルである。

【0033】

$C_1 - C_6$  アルコキシは、分子の残りの部分に酸素原子を介して結合している1 - 6個、特に1 - 4個 (=  $C_1 - C_4$  アルコキシ) の炭素原子を有する直鎖または分岐アルキル基である。例には、メトキシ、エトキシ、*n* - プロポキシ、イソプロポキシ、*n* - ブトキシ、2 - ブトキシ、イソブトキシ、*tert* - ブトキシ、ペンチルオキシ、1 - メチルブトキシ、2 - メチルブトキシ、3 - メチルブトキシ、2, 2 - ジメチルプロポキシ、1 - エチルプロポキシ、ヘキシルオキシ、1, 1 - ジメチルプロポキシ、1, 2 - ジメチルプロポキシ、1 - メチルペンチルオキシ、2 - メチルペンチルオキシ、3 - メチルペンチルオキシ、4 - メチルペンチルオキシ、1, 1 - ジメチルブチルオキシ、1, 2 - ジメチルブチルオキシ、1, 3 - ジメチルブチルオキシ、2, 2 - ジメチルブチルオキシ、2, 3 - ジメチルブチルオキシ、3, 3 - ジメチルブチルオキシ、1 - エチルブチルオキシ、2 - エチルブチルオキシ、1, 1, 2 - トリメチルプロポキシ、1, 2, 2 - トリメチルプロポキシ、1 - エチル - 1 - メチルプロポキシおよび1 - エチル - 2 - メチルプロポキシなどがある。

10

20

【0034】

フッ素化  $C_1 - C_6$  アルコキシは、1 - 6個、特に1 - 4個 (= フッ素化  $C_1 - C_4$  アルコキシ) の炭素原子を有する直鎖または分岐アルコキシ基であって、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、(R) - 1 - フルオロエトキシ、(S) - 1 - フルオロエトキシ、2 - フルオロエトキシ、1, 1 - ジフルオロエトキシ、2, 2 - ジフルオロエトキシ、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ、(R) - 1 - フルオロプロポキシ、(S) - 1 - フルオロプロポキシ、(R) - 2 - フルオロプロポキシ、(S) - 2 - フルオロプロポキシ、3 - フルオロプロポキシ、1, 1 - ジフルオロプロポキシ、2, 2 - ジフルオロプロポキシ、3, 3 - ジフルオロプロポキシ、3, 3, 3 - トリフルオロプロポキシ、(R) - 2 - フルオロ - 1 - メチルエトキシ、(S) - 2 - フルオロ - 1 - メチルエトキシ、(R) - 2, 2 - ジフルオロ - 1 - メチルエトキシ、(S) - 2, 2 - ジフルオロ - 1 - メチルエトキシ、(R) - 1, 2 - ジフルオロ - 1 - メチルエトキシ、(S) - 1, 2 - ジフルオロ - 1 - メチルエトキシ、(R) - 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メチルエトキシ、(S) - 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メチルエトキシ、2 - フルオロ - 1 - (フルオロメチル) エトキシ、1 - (ジフルオロメチル) - 2, 2 - ジフルオロエトキシ、(R) - 1 - フルオロプロポキシ、(S) - 1 - フルオロプロポキシ、2 - フルオロプロポキシ、3 - フルオロプロポキシ、4 - フルオロプロポキシ、1, 1 - ジフルオロプロポキシ、2, 2 - ジフルオロプロポキシ、3, 3 - ジフルオロプロポキシ、4, 4 - ジフルオロプロポキシ、4, 4, 4 - トリフルオロプロポキシなどにおけるように、少なくとも1個、例えば1個、2個、3個、4個もしくはは全ての水素原子がフッ素原子によって置き換わっているものである。

30

40

【0035】

$C_1 - C_6$  ヒドロキシアルキルは、2 - ヒドロキシエチルまたは3 - ヒドロキシプロピルのように、水素原子のうち1個がヒドロキシ基によって置き換わっている1から6個、特別には1から4個の炭素原子 (=  $C_1 - C_4$  ヒドロキシアルキル)、特に1から3個の炭素原子 (=  $C_1 - C_3$  ヒドロキシアルキル) を有する直鎖もしくは分岐のアルキル基である。

【0036】

$C_1 - C_6$  - アルコキシ -  $C_1 - C_6$  - アルキルは、メトキシメチル、2 - メトキシエチル、エトキシメチル、3 - メトキシプロピル、3 - エトキシプロピルなどでのように、

50

水素原子のうちの1個が $C_1 - C_6$ -アルコキシ基によって置き換わっている1から6個、特別には1から4個の炭素原子、特には1から3個の炭素原子を有する直鎖もしくは分岐のアルキル基である。

【0037】

$C_1 - C_6$ -アルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルコキシは、2-メトキシエトキシ、エトキシメトキシ、2-エトキシエトキシ、3-メトキシプロポキシ、3-エトキシプロポキシなどのように、水素原子のうちの1個が $C_1 - C_6$ -アルコキシ基によって置き換わっている1から6個、特別には1から4個の炭素原子、特には1から3個の炭素原子を有する直鎖もしくは分岐のアルキル基である。

【0038】

$C_1 - C_6$ -アルキルカルボニルは、アセチルおよびプロピオニルのように、水素原子のうちの1個がカルボニル基(CO)によって置き換わっている1から6個、特別には1から4個の炭素原子、特には1から3個の炭素原子を有する直鎖もしくは分岐のアルキル基である。

【0039】

フッ素化 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニルは、トリフルオロアセチルおよび3,3,3-トリフルオロプロピオニルのように、水素原子のうちの1個がカルボニル基(CO)によって置き換わっており、残りの水素原子のうちの少なくとも1個、例えばそれらの水素原子のうちの1、2、3もしくは4個がフッ素によって置き換わっている1から6個、特別には1から4個の炭素原子(=フッ素化 $C_1 - C_4$ アルキルカルボニル)、特には1から3個の炭素原子(=フッ素化 $C_1 - C_3$ アルキルカルボニル)を有する直鎖もしくは分岐のアルキル基である。

【0040】

$C_1 - C_6$ -アルキルカルボニルアミノは、アセトアミド(アセチルアミノ)( $CH_3CONH-$ )およびプロピオンアミド( $CH_3CH_2CONH-$ )のように、水素原子のうちの1個がカルボニルアミノ基(CO-NH-)によって置き換わっている1から6個、特別には1から4個の炭素原子(= $C_1 - C_4$ アルキルカルボニルアミノ)、特には1から3個の炭素原子(= $C_1 - C_3$ アルキルカルボニルアミノ)を有する直鎖もしくは分岐のアルキル基である。

【0041】

フッ素化 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニルアミノは、トリフルオロアセチルアミノおよび3,3,3-トリフルオロプロピオニルアミノのように、水素原子のうちの1個がカルボニルアミノ基(CO-NH-)によって置き換わっており、残りの水素原子のうちの少なくとも1個、例えばそれらの水素原子のうちの1、2、3もしくは4個がフッ素原子によって置き換わっている、1から6個、特別には1から4個の炭素原子(=フッ素化 $C_1 - C_4$ アルキルカルボニルアミノ)、特には1から3個の炭素原子(=フッ素化 $C_1 - C_3$ アルキルカルボニルアミノ)を有する直鎖もしくは分岐のアルキル基である。

【0042】

$C_1 - C_6$ アルキルチオ( $C_1 - C_6$ -アルキルスルファニルとも称される)(または、それぞれ $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニルまたは $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル)は、アルキル基におけるいずれかの結合で、硫黄原子(または、それぞれアルキルスルフィニルの場合にはS(O)O、またはアルキルスルホニルの場合にはS(O)<sub>2</sub>O)を介して分子の残りの部分に結合している、1から6個の炭素原子、例えば1から4個の炭素原子を有する直鎖もしくは分岐のアルキル基を指す。 $C_1 - C_4$ -アルキルチオの例にはメチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオおよびn-ブチルチオなどがある。 $C_1 - C_4$ -アルキルスルフィニルの例には、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニルおよびn-ブチルスルフィニルなどがある。 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホニルの例には、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およびn-ブチルスルホニルなどがある。

10

20

30

40

50

## 【0043】

フッ素化  $C_1 - C_6$  アルキルチオ（フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルキルスルファニルとも称される）は、少なくとも1個、例えば1、2、3、4もしくは全ての水素原子がフッ素原子によって置き換わっている1から6個、特に1から4個の炭素原子を有する直鎖もしくは分岐のアルキルチオ基である。フッ素化  $C_1 - C_6$  アルキルスルフィニルは、少なくとも1個、例えば1、2、3、4もしくは全ての水素原子がフッ素原子によって置き換わっている1から6個、特に1から4個の炭素原子を有する直鎖もしくは分岐のアルキルスルフィニル基である。フッ素化  $C_1 - C_6$  アルキルスルホニルは、少なくとも1個、例えば1、2、3、4もしくは全ての水素原子がフッ素原子によって置き換わっている1から6個、特に1から4個の炭素原子を有する直鎖もしくは分岐のアルキルスルホニル基

10

## 【0044】

$C_3 - C_6$  シクロアルキルは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルなどの、3から6個のC原子を有する脂環式の基である。シクロアルキル基は、非置換であることができ、または1、2、3または4個の  $C_1 - C_4$  アルキル基、好ましくはメチル基を有することができる。好ましくは、1 - メチルシクロプロピルまたは1 - メチルシクロブチルのように、1個のアルキル基がシクロアルキル基の1位にある。

## 【0045】

フッ素化  $C_3 - C_6$  シクロアルキルは、1 - フルオロシクロプロピル、2 - フルオロシクロプロピル、(S) - および (R) - 2, 2 - ジフルオロシクロプロピル、1, 2 - ジフルオロシクロプロピル、2, 3 - ジフルオロシクロプロピル、ペンタフルオロシクロプロピル、1 - フルオロシクロブチル、2 - フルオロシクロブチル、3 - フルオロシクロブチル、2, 2 - ジフルオロシクロブチル、3, 3 - ジフルオロシクロブチル、1, 2 - ジフルオロシクロブチル、1, 3 - ジフルオロシクロブチル、2, 3 - ジフルオロシクロブチル、2, 4 - ジフルオロシクロブチルまたは1, 2, 2 - トリフルオロシクロブチルのように、少なくとも1個、例えば1、2、3、4個もしくは全ての水素原子がフッ素原子によって置き換わっているシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルなどの3から6個のC原子を有する脂環式基である。

20

## 【0046】

$C_2 - C_6$  - アルケニルは、例えばビニル、アリル（2 - プロペン - 1 - イル）、1 - プロペン - 1 - イル、2 - プロペン - 2 - イル、メタリル（2 - メチルプロブ - 2 - エン - 1 - イル）などの2、3、4、5もしくは6個の炭素原子を有するモノ不飽和炭化水素基である。 $C_3 - C_6$  - アルケニルは、特に、アリル、1 - メチルプロブ - 2 - エン - 1 - イル、2 - ブテン - 1 - イル、3 - ブテン - 1 - イル、メタリル、2 - ペンテン - 1 - イル、3 - ペンテン - 1 - イル、4 - ペンテン - 1 - イル、1 - メチルブト - 2 - エン - 1 - イルまたは2 - エチルプロブ - 2 - エン - 1 - イルである。

30

## 【0047】

フッ素化  $C_2 - C_6$  - アルケニルは、1 - フルオロビニル、2 - フルオロビニル、2, 2 - フルオロビニル、3, 3, 3 - フルオロプロペニル、1, 1 - ジフルオロ - 2 - プロペニル 1 - フルオロ - 2 - プロペニルなどでのように、少なくとも1個、例えば1、2、3、4個もしくは全ての水素原子がフッ素原子によって置き換わっている2、3、4、5もしくは6個のC原子を有するモノ不飽和炭化水素基である。

40

## 【0048】

$C_1 - C_6$  - アルキレンは、メチレン、エチレン、1, 2 - および 1, 3 - プロピレン、1, 4 - ブチレンなどのような1、2、3、4、5もしくは6個の炭素原子を有する炭化水素架橋基である。

## 【0049】

5員もしくは6員のヘテロ芳香族基の例には、2 - 、3 - もしくは4 - ピリジル、2 - 、4 - もしくは5 - ピリミジニル、ピラジニル、3 - もしくは4 - ピリダジニル、2 - も

50

しくは3 - チエニル、2 - もしくは3 - フリル、2 - もしくは3 - ピロリル、2 - 、3 - もしくは5 - オキサゾリル、3 - 、4 - もしくは5 - イソオキサゾリル、2 - 、3 - もしくは5 - チアゾリル、3 - 、4 - もしくは5 - イソチアゾリル、3 - 、4 - もしくは5 - ピラゾリル、2 - 、4 - もしくは5 - イミダゾリル、2 - もしくは5 - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾリル、4 - もしくは5 - [ 1 , 2 , 3 ] オキサジアゾリル、3 - もしくは5 - [ 1 , 2 , 4 ] オキサジアゾリル、2 - もしくは5 - [ 1 , 3 , 4 ] チアジアゾリル、2 - もしくは5 - [ 1 , 3 , 4 ] チアジアゾリル、4 - もしくは5 - [ 1 , 2 , 3 ] チアジアゾリル、3 - もしくは5 - [ 1 , 2 , 4 ] チアジアゾリル 1 H - 、2 H - もしくは3 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル、2 H - トリアゾール - 3 - イル、1 H - 、2 H - もしくは4 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾリルおよび1 H - もしくは2 H - テトラゾリルが含まれ、それらは非置換であることができ、または1、2または3個の上記の基 R<sup>a</sup> を有することができる。

10

## 【0050】

飽和もしくは不飽和5員もしくは6員の炭素環もしくは複素環に縮合したフェニル環の例には、インデニル、インダニル、ナフチル、1, 2 - もしくは2, 3 - ジヒドロナフチル、テトラリン、ベンゾフラニル、2, 3 - ジヒドロベンゾフラニル、ベンゾチエニル、インドリル、インダゾリル、ベンズイミダゾリル、ベンゾオキサチアゾリル、ベンゾオキサジアゾリル、ベンゾチアジアゾリル、ベンゾオキサジニル、ジヒドロベンゾオキサジニル、キノリニル、イソキノリニル、テトラヒドロイソキノリニル、クロメニル、クロマニルなどが含まれ、それらは非置換であることができ、または1、2もしくは3個の上記の基 R<sup>a</sup> を有することができる。この縮合系は、フェニル部分の炭素原子を介して、またはフェニルに縮合した環の環原子 (C - もしくはN - 原子) を介して、分子の残りの部分に (より正確にはスルホニル基に) 結合していることができる。

20

## 【0051】

飽和もしくは不飽和の3から7員の複素環 (基 R<sup>a</sup> として) の例には、飽和もしくは不飽和の芳香族もしくは非芳香族複素環が含まれる。従って、例としては、上記で定義の5員もしくは6員のヘテロ芳香族基は別として、アジリジル、ジアジリジニル、オキシラニル、アゼチジニル、アゼチニル、ジ - およびテトラヒドロフラニル、ピロリル、ピロリジニル、オキソピロリジニル、ピラゾリニル、ピラゾリジニル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、オキサゾリニル、オキサゾリジニル、オキソ - オキサゾリジニル、イソオキサゾリニル、イソオキサゾリジニル、ペペリジニル、ペペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、オキソチオモルホリニル、ジオキソチオモルホリニルなどがある。

30

## 【0052】

R<sup>6</sup> および R<sup>7</sup> が N と一体となって、4、5員もしくは6員の環を形成している場合、この種の基の例には、上記で定義の環員として少なくとも1個のN原子を含む上記で定義の5員もしくは6員のヘテロ芳香族基を別として、アゼチジニル、アゼチニル、ピロリル、ピロリジニル、ピラゾリニル、ピラゾリジニル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、オキサゾリニル、オキサゾリジニル、ペペリジニル、ペペラジニル、モルホリニルなどが含まれる。

40

## 【0053】

式 I の化合物において、n は好ましくは0または1である。すなわち、窒素含有環 B はアゼチジニル基またはピロリジニル基であり、特に n は1であり、それは、特に好ましい実施形態において、窒素含有環 B がピロリジニル環であることを意味している。

## 【0054】

好ましくは、基 R<sup>1</sup> は、H、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキルまたはヒドロキシによって置換されている C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルおよび C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニルから選択される。より好ましいものは、H、プロピル、シクロプロピルメチレン、フッ素化エチル、例えば2 - フルオロエチル、フッ素化プロピル、例えば3 - フルオロプロピル、ヒドロキシプロピル、例えば3 - ヒドロキシプロピル、プロピオニルおよびアリルである。より好ましくは、R<sup>1</sup> は、から選択されH、プロ

50

ピル、エチル、メチル、シクロプロピルメチレン、2 - フルオロエチル、3 - フルオロプロピル、3 - ヒドロキシプロピルおよびアリルである。さらにより好ましくは、 $R^1$  はから選択されH、プロピル、シクロプロピルメチレン、2 - フルオロエチル、3 - フルオロプロピル、3 - ヒドロキシプロピルおよびアリルである。特に好ましい実施形態では、 $R^1$  はH、*n* - プロピルまたはアリル、特にHまたは*n* - プロピル、特別にはHである。

## 【0055】

好ましくは、 $R^2$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  および  $R^4$  はHである。

## 【0056】

ある好ましい実施形態において、Dは式Bの基である。

## 【0057】

別の好ましい実施形態において、Dは式Cの基である。

## 【0058】

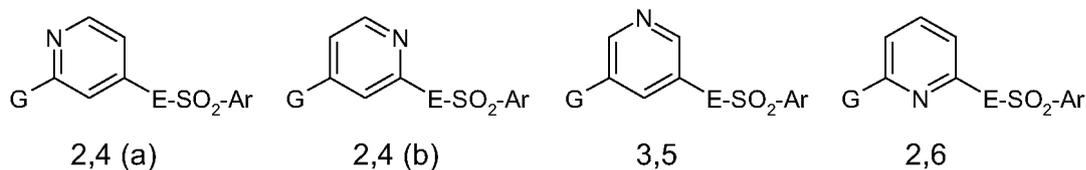
基Aが置換されている場合、好ましい置換基はハロゲン、特にフッ素、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、ジフルオロメトキシおよびトリフルオロメトキシから選択される。より好ましい置換基は、ハロゲン、特にフッ素、メチルおよびメトキシから選択される。具体的には、その置換基はメトキシである。例としては、2 - メトキシ - 3, 5 - ピリジレン、4 - メトキシ - 3, 5 - ピリジレン、3 - メトキシ - 2, 4 - ピリジレン、5 - メトキシ - 2, 4 - ピリジレン、6 - メトキシ - 2, 4 - ピリジレン、3 - メトキシ - 2, 6 - ピリジレン、4 - メトキシ - 2, 6 - ピリジレン、2 - フルオロ - 3, 5 - ピリジレン、4 - フルオロ - 3, 5 - ピリジレン、3 - フルオロ - 2, 4 - ピリジレン、5 - フルオロ - 2, 4 - ピリジレン、6 - フルオロ - 2, 4 - ピリジレン、3 - フルオロ - 2, 6 - ピリジレン、4 - フルオロ - 2, 6 - ピリジレン、2 - メチル - 3, 5 - ピリジレン、4 - メチル - 3, 5 - ピリジレン、3 - メチル - 2, 4 - ピリジレン、5 - メチル - 2, 4 - ピリジレン、6 - メチル - 2, 4 - ピリジレン、3 - メチル - 2, 6 - ピリジレン、4 - メチル - 2, 6 - ピリジレンなどがある。ある具体的な実施形態では、Aは2, 4 - もしくは3, 5 - ピリジレンであり、それは非置換であるかメトキシによって置換されている。

## 【0059】

Aは、窒素原子の1位に関して2, 4 - ピリジレン3, 5 - ピリジレンまたは2, 6 - ピリジレンである。これは、下記の結合位置に相当する。

## 【0060】

## 【化6】



## 【0061】

好ましくは、Aは2, 4 - ピリジレン（好ましくは (a)）または3, 5 - ピリジレンであり、それはハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、フッ素化 $C_1 - C_4$  - アルキルおよびフッ素化 $C_1 - C_4$  - アルコキシから選択される1以上の置換基によって置換されていても良い。好ましくは、その置換基はハロゲン、特にフッ素、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロ - メチル、メトキシ、ジフルオロメトキシおよびトリフルオロメトキシから選択される。より好ましい置換基は、ハロゲン、特にフッ素、メチルおよびメトキシから選択される。より好ましくは、Aは2, 4 - ピリジレン（好ましくは (a)）または3, 5 - ピリジレンであり、それはハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、フッ素化 $C_1 - C_4$  - アルキルおよびフッ素化 $C_1 - C_4$  - アルコキシから選択される1以上の置換基によって置換されていても良い。好ましくは、その置換基は、ハロゲン、特にフッ素、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメ

10

20

30

40

50

チル、メトキシ、ジフルオロメトキシおよびトリフルオロメトキシから選択される。より好ましい置換基は、ハロゲン、特にフッ素、メチルおよびメトキシから選択される。特に、Aは2, 4-もしくは3, 5-ピリジレンであり、それは非置換であるか1個のメトキシ基によって置換されている。ある具体的な実施形態では、Aは3, 5-ピリジレンであり、それは非置換であるかメトキシによって置換されている。

【0062】

基Eは、好ましくはNR<sup>5</sup>、より好ましくはNHまたはNCH<sub>3</sub>、特にNHである。

【0063】

基Arの好ましい環状基は、フェニル、2-もしくは3-チエニル、特に2-チエニル、イミダゾリル、特に4-イミダゾリル、イソオキサゾリル、特に4-イソオキサゾリル、チアゾリル、特に2-チアゾリル、トリアゾリル、特に3-[1, 2, 4]トリアゾリル、チアジアゾリル、特に3-および5-[1, 2, 4]チアジアゾリルおよび2-[1, 3, 4]チアジアゾリル、2-、3-もしくは4-ピリジル、2-および5-ピリミジニル、1-、2-、3-、4-もしくは5-インダニル、2-、3-、4-もしくは5-ベンゾフラニル、キノリニル、特に8-キノリニル、イソキノリニル、特に5-イソキノリニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリニル、特に7-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-7-イル、ベンゾチエニル、特に2-ベンゾチエニル、ベンゾチアゾリル、特に6-ベンゾチアゾリル、ベンゾオキサジアゾリル、特に4-[2, 1, 3]ベンゾオキサジアゾリル、ベンゾチアジアゾリル、特に4-[2, 1, 3]ベンゾチアジアゾリル、ベンゾオキサジンおよびジヒドロベンゾオキサジンである。数字は、Arがスルホニル基に結合している位置を示す。より好ましい基Arは、フェニル、2-チエニル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、5-インダニル、2-ベンゾフラニル、2-ベンゾチエニルおよび2, 3-ジヒドロベンゾフラン-2-イルである。さらにより好ましい基Arは、フェニル、チエニル、特に2-チエニル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、5-インダニル、ベンゾフラン-2-イル、2-ベンゾチエニルおよび2, 3-ジヒドロベンゾフラン-2-イルである。特に好ましい基Arは、フェニル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、チエニル、特に2-チエニル、および2-ベンゾチエニルおよび特にフェニル、チエニル、特に2-チエニル、および2-ベンゾチエニルである。具体的には、Arはフェニルまたはチエニル、特に2-チエニル、より具体的にはフェニルである。

【0064】

ある好ましい実施形態において、環状基Arは非置換であるかハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-ヒドロキシアルキル、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-アルケニル、フッ素化C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-アルケニル、NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、ONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキレン-NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>(R<sup>6</sup>およびR<sup>7</sup>は互いに独立にH、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルまたはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシである。)、ウレイド(NHCONH<sub>2</sub>)C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、フッ素化C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、アセチル、カルボキシル、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、ベンゾオキシ、メチルスルファニル、フルオロメチルスルファニル、ジ-フルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルファニル、メチルスルホニルおよび上記で定義のように置換されていても良い上記の飽和もしくは不飽和3から7員の複素環のうちのいずれかからなる群から選択される1、2もしくは3個の置換基R<sup>a</sup>によって置換されている。より好ましい実施形態では、R<sup>a</sup>は、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、フッ素化C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、OCF<sub>3</sub>、OCHF<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>F、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-アルケニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、フッ素化C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル、ウレイド、アセチル、カルボキシル、ヒドロキシ、シアノ、ベンゾオキシ、トリフルオロメチルスルファニル、メチルスルホニル、アゼチジン-1-イル、2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル、ピロリジン-1-イル、3, 3-ジフルオロピロリジン-1-イル、2-オキソ-ピロリジン-1-イル、2-オキソ-オキサゾリジン-1-イル、ピペリジン-1-イル、2-フルオロ

ピペリジン - 1 - イル、2, 2 - ジフルオロピペリジン - 1 - イル、モルホリン - 4 - イル、および 1, 2, 3 もしくは 4 個のヘテロ原子または O、S、N および NR<sup>9</sup> ( R<sup>9</sup> は、上記で定義の通りであり、上記で定義のように置換されていても良い。 ) から選択されるヘテロ原子含有基を含む 5 員もしくは 6 員のヘテロ芳香族環からなる群から選択される。

【 0 0 6 5 】

そのような 5 員もしくは 6 員のヘテロ芳香族環の例には、ピロール - 1 - イル、ピロール - 2 - イルもしくはピロール - 3 - イルなどのピロリル、2 - フラニルもしくはフラン - 3 - イルなどのフラニル、チエン - 2 - イル、チエン - 3 - イルもしくは 5 - プロピルチエン - 2 - イルなどのチエニル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イル、ピラゾール - 5 - イル、1 - メチルピラゾール - 4 - イル、1 - エチルピラゾール - 4 - イルもしくは 4 - フルオロピラゾール - 1 - イルなどのピラゾリル、イミダゾリルなどのイミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、イミダゾール - 4 - イルもしくはイミダゾール - 5 - イル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イルもしくはオキサゾール - 5 - イルなどのオキサゾリル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イルもしくはイソオキサゾール - 5 - イルなどのイソオキサゾリル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イル、チアゾール - 5 - イル、2 - メチルチアゾール - 4 - イルもしくは 2 - メチルチアゾール - 5 - イルなどのチアゾリル、イソチアゾール - 3 - イル、イソチアゾール - 4 - イルもしくはイソチアゾール - 5 - イルなどのイソチアゾリル、[ 1, 2, 3 ] - 1 H - トリアゾール - 1 - イル、[ 1, 2, 3 ] - 1 H - トリアゾール - 4 - イル、[ 1, 2, 3 ] - 1 H - トリアゾール - 5 - イル、[ 1, 2, 4 ] - 1 H - トリアゾール - 1 - イル、[ 1, 2, 4 ] - 1 H - トリアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 4 ] - 1 H - トリアゾール - 5 - イル、[ 1, 3, 4 ] - 1 H - トリアゾール - 1 - イル、[ 1, 3, 4 ] - 1 H - トリアゾール - 2 - イル、[ 1, 3, 4 ] - 1 H - トリアゾール - 5 - イル、[ 1, 2, 3 ] - 2 H - トリアゾール - 2 - イル、[ 1, 2, 3 ] - 2 H - トリアゾール - 4 - イルおよび [ 1, 2, 3 ] - 2 H - トリアゾール - 5 - イルなどのトリアゾリル、オキサジアゾリルなどの [ 1, 2, 3 ] オキサジアゾール - 4 - イル、[ 1, 2, 3 ] オキサジアゾール - 5 - イル、[ 1, 2, 4 ] オキサジアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 4 ] オキサジアゾール - 5 - イル、[ 1, 3, 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル、および [ 1, 3, 4 ] オキサジアゾール - 5 - イル、[ 1, 2, 3 ] チアジアゾール - 4 - イル、[ 1, 2, 3 ] チアジアゾール - 5 - イル、[ 1, 2, 4 ] チアジアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 4 ] チアジアゾール - 5 - イル、[ 1, 3, 4 ] チアジアゾール - 2 - イルおよび [ 1, 3, 4 ] チアジアゾール - 5 - イルなどのチアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 3 - イルなどのピリジリル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イルなどのピリミジニル、ピラジニルおよびピリダジニルがある。さらにより好ましくは、R<sup>a</sup> は、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、OCF<sub>3</sub>、OCHF<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>F、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フッ素化 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、ウレイド、アセチル、カルボキシル、ヒドロキシ、ベンゾオキシ、トリフルオロメチルスルファニル、アゼチジン - 1 - イル、2, 2 - ジフルオロアゼチジン - 1 - イル、ピロリジン - 1 - イル、3, 3 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル、2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル、2 - フルオロピペリジン - 1 - イル、2, 2 - ジフルオロピペリジン - 1 - イル、モルホリン - 4 - イル、ピロール - 1 - イル、フラン - 2 - イル、ピラゾール - 1 - イル、1 - メチルピラゾール - 4 - イル、4 - フルオロピラゾール - 1 - イル、オキサゾール - 5 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イル、チアゾール - 5 - イル、2 - メチルチアゾール - 4 - イル、2 - メチルチアゾール - 5 - イルおよび 4 - [ 1, 2, 3 ] チアジアゾリルからなる群から選択される。

【 0 0 6 6 】

A r がヘテロ芳香族環である場合、この場合の R<sup>a</sup> は特にハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アル

キル、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $OCF_3$ 、 $OCHF_2$ 、 $OCH_2F$ 、 $C_2 - C_4$  - アルケニル、フェニル、フェニルスルホニル、ピリジルスルホニル、ピリジルメチル（最後に言及した2個の基におけるピリジル基は上記で定義のように置換されていても良い。）、アミノメチル、アセチルアミノメチル、ベンゾイルアミノメチル（最後に言及した基におけるベンゼン環は上記で定義のように置換されていても良い。）および3から7員複素環である  $R^a$  について上記で定義のように置換されていても良い5員もしくは6員のヘテロ芳香族環から選択される。より好ましくは、この場合の  $R^a$  は特に、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $OCF_3$ 、 $OCHF_2$ 、 $OCH_2F$  および上記で定義のように置換されていても良い5員もしくは6員のヘテロ芳香族環から選択される。

10

## 【0067】

好ましい5員もしくは6員のヘテロ芳香族環  $R^a$  は、ピロール - 1 - イル、ピロール - 2 - イルもしくはピロール - 3 - イルなどのピロリル、フラン - 2 - イルもしくはフラン - 3 - イルなどのフラニル、チエン - 2 - イルもしくはチエン - 3 - イルなどのチエニル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イルもしくはピラゾール - 5 - イルなどのピラゾリル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、イミダゾール - 4 - イルもしくはイミダゾール - 5 - イルなどのイミダゾリル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イルもしくはオキサゾール - 5 - イルなどのオキサゾリル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イルもしくはイソオキサゾール - 5 - イルなどのイソオキサゾリル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イルもしくはチアゾール - 5 - イルなどのチアゾリル、イソチアゾール - 3 - イル、イソチアゾール - 4 - イルもしくはイソチアゾール - 5 - イルなどのイソチアゾリル、[1, 2, 3] - 1H - トリアゾール - 1 - イル、[1, 2, 3] - 1H - トリアゾール - 4 - イル、[1, 2, 3] - 1H - トリアゾール - 5 - イル、[1, 2, 4] - 1H - トリアゾール - 1 - イル、[1, 2, 4] - 1H - トリアゾール - 3 - イル、[1, 2, 4] - 1H - トリアゾール - 5 - イル、[1, 3, 4] - 1H - トリアゾール - 1 - イル、[1, 3, 4] - 1H - トリアゾール - 2 - イル、[1, 3, 4] - 1H - トリアゾール - 5 - イル、[1, 2, 3] - 2H - トリアゾール - 2 - イル、[1, 2, 3] - 2H - トリアゾール - 4 - イルおよび[1, 2, 3] - 2H - トリアゾール - 5 - イルなどのトリアゾリル、[1, 2, 3] オキサジアゾール - 4 - イル、[1, 2, 3] オキサジアゾール - 5 - イル、[1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イル、[1, 2, 4] オキサジアゾール - 5 - イル、[1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イルおよび[1, 3, 4] オキサジアゾール - 5 - イルなどのオキサジアゾリル、[1, 2, 3] チアジアゾール - 4 - イル、[1, 2, 3] チアジアゾール - 5 - イル、[1, 2, 4] チアジアゾール - 3 - イル、[1, 2, 4] チアジアゾール - 5 - イル、[1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イルおよび[1, 3, 4] チアジアゾール - 5 - イルなどのチアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 3 - イルなどのピリジル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イルなどのピリミジニル、ピラジニルおよびピリダジニルから選択される。

20

30

## 【0068】

好ましくは、5員もしくは6員のヘテロ芳香族環  $R^a$  は、環員としての1個のN原子（5員環では、基  $NR^9$  の形であることもできる。）および場合により環員としてのO、NおよびSから選択される1個もしくは2個の別のヘテロ原子を含み、例えばピロール - 1 - イル、ピロール - 2 - イルもしくはピロール - 3 - イルなどのピロリル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イルもしくはピラゾール - 5 - イルなどのピラゾリル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、イミダゾール - 4 - イルもしくはイミダゾール - 5 - イルなどのイミダゾリル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イルもしくはオキサゾール - 5 - イルなどのオキサゾリル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イルもしくはイソオキサゾール - 5 - イルなどのイソオキサゾリル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イルもしくはチア

40

50

ゾール - 5 - イルなどのチアゾリル、イソチアゾール - 3 - イル、イソチアゾール - 4 - イルもしくはイソチアゾール - 5 - イルなどのイソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 3 - イルなどのピリジル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イルなどのピリミジニル、ピラジニルおよびピリダジニルなどがある。

【0069】

より好ましくは、ヘテロ芳香族環  $R^a$  は 5 員環である。好ましい 5 員ヘテロ芳香族環は、環員としての 1 個の N 原子 (基  $NR^9$  の形であることもできる。) および場合により環員としての O、N および S から選択される 1 個もしくは 2 個の別のヘテロ原子を含み、例えばピロール - 1 - イル、ピロール - 2 - イルもしくはピロール - 3 - イルなどのピロリル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イルもしくはピラゾール - 5 - イルなどのピラゾリル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、イミダゾール - 4 - イルもしくはイミダゾール - 5 - イルなどのイミダゾリル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イルもしくはオキサゾール - 5 - イルなどのオキサゾリル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イルもしくはイソオキサゾール - 5 - イルなどのイソオキサゾリル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イルもしくはチアゾール - 5 - イルなどのチアゾリル、イソチアゾール - 3 - イル、イソチアゾール - 4 - イルもしくはイソチアゾール - 5 - イルなどのイソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリルおよびチアジアゾリルがある。特に好ましい 5 員のヘテロ芳香族環は、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イルなどのチアゾリル、または具体的にはチアゾール - 5 - イルである。

10

20

【0070】

好ましくは、5 員もしくは 6 員のヘテロ芳香族環  $R^a$  は非置換であり、またはハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - チオアルキル、フッ素化  $C_1 - C_4$  - チオアルキル、およびアミノ -  $C_1 - C_2$  - アルキレンから選択される 1、2 もしくは 3 個、好ましくは 1 個の置換基を有する。

【0071】

$Ar$  が縮合系である場合、それは優先的には、非置換であり、または好ましくはハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキルおよびフッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキルから選択される 1 個もしくは 2 個の置換基によって置換されている。

30

【0072】

$Ar$  がヘテロ芳香族環に縮合したフェニル環である場合、それは好ましくは、ヘテロ芳香族環の炭素原子を介して  $SO_2$  基に結合している。

【0073】

上記の 5 員ヘテロ芳香族基において、 $Ar$  は好ましくは非置換であり、または 5 位 ( $SO_2$  基の 2 位に関して) に 1 個の基  $R^a$  および場合によりハロゲン、特にフッ素または塩素から選択される 1 個もしくは 2 個の別の基を有する。

【0074】

フェニルおよび上記の 6 員のヘテロ芳香族基  $Ar$  は好ましくは、2、3 もしくは 4 位、好ましくは 3 位もしくは 4 位 ( $SO_2$  基の 1 位に関して) に 1 個の基  $R^a$  および場合によりハロゲン、特にフッ素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、特にメチル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特にメトキシ、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキル、特に  $CHF_2$  または  $CF_3$  およびフッ素化  $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特に  $OCHF_2$  または  $O CF_3$  から選択される 1 個もしくは 2 個の別の基を有する。

40

【0075】

$D$  が基  $C$  であり、 $A$  は非置換 2, 4 -、2, 6 - もしくは 3, 5 - ピリジレンであり、 $Ar$  はフェニルまたは上記 6 員のヘテロ芳香族基のうちのいずれかである場合、 $Ar$  が、3 位もしくは 4 位、より好ましくは 3 位 ( $SO_2$  基の 1 位に関して) に 1 個の基  $R^a$  および場合によりハロゲン、特にフッ素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、特にメチル、 $C_1 - C_4$  -

50

アルコキシ、特にメトキシ、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキル、特に  $CHF_2$  または  $CF_3$ 、およびフッ素化  $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特に  $OCHF_2$  または  $OCF_3$  から選択される 1 個もしくは 2 個の別の基を有することが好ましい。

【0076】

D が基 C であり、Ar がフェニルまたは前記 6 員ヘテロ芳香族基のいずれかである場合、Ar が 3 位もしくは 4 位、より好ましくは 3 位 ( $SO_2$  基の 1 位に関して) に 1 個の基  $R^a$  および場合によりハロゲン、特にフッ素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、特にメチル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特にメトキシ、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキル、特に  $CHF_2$  または  $CF_3$ 、およびフッ素化  $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特に  $OCHF_2$  または  $OCF_3$  から選択される 1 個もしくは 2 個の別の基を有することが好ましい。

10

【0077】

非常に好ましい実施形態において、本発明の Ar は、フェニル環の 4 位に 1 個の基  $R^a$  および場合によりハロゲン、特にフッ素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、特にメチル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特にメトキシ、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキル、特に  $CHF_2$  または  $CF_3$ 、およびフッ素化  $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特に  $OCHF_2$  または  $OCF_3$  から選択される 1 個もしくは 2 個の別の基を有するフェニルである。この場合に、A がさらに非置換 2, 4 -、2, 6 - もしくは 3, 5 - ピリジレンである場合、D は基 C ではないことが好ましい。

【0078】

あるいは、非常に本発明の好ましい実施形態では、Ar は、フェニル環の 3 位に 1 個の基  $R^a$  および場合によりハロゲン、特にフッ素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、特にメチル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特にメトキシ、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキル、特に  $CHF_2$  または  $CF_3$ 、およびフッ素化  $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特に  $OCHF_2$  または  $OCF_3$  から選択される 1 個もしくは 2 個の別の基を有するフェニルである。

20

【0079】

あるいは、本発明の非常に好ましい実施形態では、Ar は、ピリジル環の 4 位もしくは 6 位における 1 個の基  $R^a$  および場合により 1 個もしくは 2 個の別の基から選択されるハロゲン、特にフッ素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、特にメチル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特にメトキシ、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキル、特に  $CHF_2$  または  $CF_3$ 、およびフッ素化  $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特に  $OCHF_2$  または  $OCF_3$  を有する 2 - ピリジル (ピリジルの窒素原子の 1 位に関して) である。

30

【0080】

あるいは、本発明の非常に好ましい実施形態において、Ar は、ピリジル環の 5 位に 1 個の基  $R^a$  および場合によりハロゲン、特にフッ素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、特にメチル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特にメトキシ、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキル、特に  $CHF_2$  または  $CF_3$ 、およびフッ素化  $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特に  $OCHF_2$  または  $OCF_3$  から選択される 1 個もしくは 2 個の別の基を有する 2 - ピリジル (ピリジルの窒素原子の 1 位に関して) である。この場合に、A がさらに非置換 2, 4 -、2, 6 - もしくは 3, 5 - ピリジレンである場合、D は基 C ではないことが好ましい。

【0081】

あるいは、本発明の非常に好ましい実施形態において、Ar は、ピリジル環の 5 位における 1 個の基  $R^a$  および場合により 1 個もしくは 2 個の別の基から選択されるハロゲン、特にフッ素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、特にメチル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特にメトキシ、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキル、特に  $CHF_2$  または  $CF_3$ 、およびフッ素化  $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特に  $OCHF_2$  または  $OCF_3$  を有する 3 - ピリジル (ピリジルの窒素原子の 1 位に関して) である。

40

【0082】

あるいは、本発明の好ましい実施形態において、Ar は、ピリジル環の 6 位における 1 個の基  $R^a$  および場合によりハロゲン、特にフッ素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、特にメチル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特にメトキシ、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキル、特に  $CHF_2$

50

2 または  $CF_3$ 、およびフッ素化  $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特に  $OCHF_2$  または  $OCF_3$  から選択される 1 個もしくは 2 個の別の基を有する 3 - ピリジル (ピリジルの窒素原子の 1 位に関して) である。この場合に、A がさらに非置換 2, 4 -、2, 6 - もしくは 3, 5 - ピリジンである場合、D は基 C ではないことが好ましい。

【0083】

あるいは、本発明の非常に好ましい実施形態において、Ar は、ピリジン環の 2 位における 1 個の基  $R^a$  および場合によりハロゲン、特にフッ素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、特にメチル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特にメトキシ、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキル、特に  $CHF_2$  または  $CF_3$ 、およびフッ素化  $C_1 - C_4$  - アルコキシ、特に  $OCHF_2$  または  $OCF_3$  から選択される 1 個もしくは 2 個の別の基を有する 4 - ピリジン (ピリジルの窒素原子の 1 位に関して) である。

10

【0084】

あるいは、本発明の非常に好ましい実施形態において、Ar は、非置換であり、または 1、2 もしくは 3 個の置換基  $R^a$  を有する 2 - もしくは 3 - チエニル、好ましくは 2 - チエニル (チエニルの硫黄原子の 1 位に関して) である。 $R^a$  の好ましい意味は、ヘテロ芳香族環である Ar について上記で定義の通りである。チエニル環 Ar が 1 個の置換基  $R^a$  を有する場合、これは好ましくは 5 位で結合している。

【0085】

好ましくは、 $R^a$  は、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ -  $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、フッ素化  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ、 $C_1 - C_6$  - アルコキシ -  $C_1 - C_6$  - アルコキシ、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルコキシ、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル、フェニルスルホニル、ベンジルオキシ、フェノキシ、CN、ニトロ、アセチル、トリフルオロアセチル、アセトアミド、カルボキシ、 $NH - C(O) - NH_2$ 、 $NR^6R^7$ 、 $NR^6R^7 - C_1 - C_6$  - アルキレン、 $O - NR^6R^7$  ( $R^6$  および  $R^7$  は互いに独立に、H、 $C_1 - C_4$  - アルキル、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキルまたは  $C_1 - C_4$  - アルコキシである。)、および環員としての N、O および S から選択される 1、2、3 もしくは 4 個のヘテロ原子および / または  $NR^9$  ( $R^9$  は、 $R^8$  について示した意味のうちのいずれかを有する。)、SO、 $SO_2$  および CO から選択される 1、2 もしくは 3 個のヘテロ原子含有基を含む飽和もしくは不飽和 3 から 7 員複素環からなる群から選択され、前記 3 から 7 員の複素環は、ヒドロキシ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、フッ素化  $C_1 - C_6$  - アルキルおよび  $C_1 - C_6$  - アルコキシから選択される 1、2 もしくは 3 個の置換基を有することができる。

20

30

【0086】

好ましくは、飽和もしくは不飽和の 3 から 7 員複素環  $R^a$  は、アゼチジン - 1 - イル、2 - メチルアゼチジニル、3 - メトキシアゼチジニル、3 - ヒドロキシアゼチジニル、3 - フルオロアゼチジニル、ピロリジン - 1 - イル、ピロリジン - 2 - イル、ピロリジン - 3 - イル、2 - および 3 - フルオロピロリジン - 1 - イル、2, 2 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル、3, 3 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル、2 - および 3 - メチルピロリジン - 1 - イル、1 - メチルピロリジン - 2 - イル、2, 2 - ジメチルピロリジン - 1 - イル、3, 3 - ジメチルピロリジン - 1 - イル、2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル、2 - および 3 - トリフルオロメチルピロリジン - 1 - イル、2 - オキソ - オキサゾリジン - 1 - イル、ピペリジン - 1 - イル、2 - メチルピペリジン - 1 - イル、ピペラジン - 1 - イル、4 - メチルピペラジン - 1 - イル、モルホリン - 4 - イル、チオモルホリン - 4 - イル、1 - オキソチオモルホリン - 4 - イル、1, 1 - ジオキソチオモルホリン - 4 - イル、ピロール - 1 - イル、ピロール - 2 - イル、ピロール - 3 - イル、1 - メチルピロール - 2 - イル、1 - メチルピロール - 3 - イル、フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、チオフエン - 2 - イル、チオフエン - 3 - イル、5 - プロピルチオフエン - 2 - イル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イル、ピラゾール - 5 -

40

50

イル、1 - メチルピラゾール - 4 - イル、1 - メチルピラゾール - 5 - イル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、イミダゾール - 4 - イル、イミダゾール - 5 - イル、1 - メチルイミダゾール - 2 - イル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イル、チアゾール - 5 - イル、2 - メチルチアゾール - 4 - イル、[ 1, 2, 3 ] - 1 H - トリアゾール - 1 - イル、[ 1, 2, 3 ] - 1 H - トリアゾール - 4 - イル、[ 1, 2, 3 ] - 1 H - トリアゾール - 5 - イル、[ 1, 2, 3 ] - 2 H - トリアゾール - 2 - イル、[ 1, 2, 4 ] - 1 H - トリアゾール - 1 - イル、[ 1, 2, 4 ] - 1 H - トリアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 4 ] - 1 H - トリアゾール - 5 - イル、4 - メチル - [ 1, 2, 4 ] トリアゾール - 3 - イル、2 - メチル - [ 1, 2, 3 ] トリアゾール - 4 - イル、[ 1, 3, 4 ] - オキサジアゾール - 2 - イル、[ 1, 2, 4 ] - オキサジアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 4 ] - オキサジアゾール - 5 - イル、[ 1, 2, 3 ] - オキサジアゾール - 5 - イル、[ 1, 3, 4 ] - オキサジアゾール - 2 - イル、5 - メチル - [ 1, 3, 4 ] - オキサジアゾール - 2 - イル、5 - メチル - [ 1, 2, 4 ] - オキサジアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 3 ] チアジアゾール - 4 - イル、[ 1, 2, 3 ] チアジアゾール - 5 - イル、[ 1, 2, 4 ] チアジアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 4 ] チアジアゾール - 5 - イル、[ 1, 3, 4 ] チアジアゾール - 2 - イル、テトラゾール - 1 - イル、テトラゾール - 5 - イル、2 - メチルテトラゾール - 5 - イル、1 - メチルテトラゾール - 5 - イル、フラザン - 3 - イル、ピリド - 2 - イル、ピリド - 3 - イル、ピリド - 4 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イルおよび 2 - メチルピリミジン - 4 - イルから選択される。

10

20

30

40

50

【 0 0 8 7 】

より好ましくは、飽和もしくは不飽和 3 から 7 員複素環 R<sup>a</sup> は、アゼチジン - 1 - イル、2 - メチルアゼチジニル、3 - メトキシアゼチジニル、3 - ヒドロキシアゼチジニル、3 - フルオロアゼチジニル、ピロリジン - 1 - イル、ピロリジン - 2 - イル、ピロリジン - 3 - イル、2 - および 3 - フルオロピロリジン - 1 - イル、2, 2 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル、3, 3 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル、2 - および 3 - メチルピロリジン - 1 - イル、1 - メチルピロリジン - 2 - イル、2, 2 - ジメチルピロリジン - 1 - イル、3, 3 - ジメチルピロリジン - 1 - イル、2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル、2 - および 3 - トリフルオロメチルピロリジン - 1 - イル、2 - オキソ - オキサゾリジン - 1 - イル、ペペリジン - 1 - イル、2 - メチルペペリジン - 1 - イル、ペペラジン - 1 - イル、4 - メチルペペラジン - 1 - イル、モルホリン - 4 - イル、チオモルホリン - 4 - イル、1 - オキソチオモルホリン - 4 - イル、1, 1 - ジオキソチオモルホリン - 4 - イル、ピロール - 1 - イル、ピロール - 2 - イル、ピロール - 3 - イル、1 - メチルピロール - 2 - イル、1 - メチルピロール - 3 - イル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イル、1 - メチルピラゾール - 4 - イル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、1 - メチルイミダゾール - 2 - イル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イル、チアゾール - 5 - イル、2 - メチルチアゾール - 4 - イル、[ 1, 2, 3 ] トリアゾール - 1 - イル、[ 1, 2, 4 ] トリアゾール - 1 - イル、[ 1, 2, 3 ] トリアゾール - 2 - イル、[ 1, 2, 4 ] トリアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 4 ] トリアゾール - 4 - イル、4 - メチル - [ 1, 2, 4 ] トリアゾール - 3 - イル、2 - メチル - [ 1, 2, 3 ] トリアゾール - 4 - イル、[ 1, 3, 4 ] - オキサジアゾール - 2 - イル、[ 1, 2, 4 ] - オキサジアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 4 ] - オキサジアゾール - 5 - イル、[ 1, 2, 3 ] - オキサジアゾール - 5 - イル、[ 1, 3, 4 ] - オキサジアゾール - 2 - イル、5 - メチル - [ 1, 3, 4 ] - オキサジアゾール - 2 - イル、5 - メチル - [ 1, 2, 4 ] - オキサジアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 3 ] チアジアゾール - 4 - イル、テトラゾール - 1 - イル、テトラゾール - 5 - イル、2 - メチル

テトラゾール - 5 - イル、1 - メチルテトラゾール - 5 - イル、フラザン - 3 - イル、ピリド - 2 - イル、ピリド - 3 - イル、ピリド - 4 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イルおよび 2 - メチルピリミジン - 4 - イルなどの窒素含有環から選択される。

【0088】

さらにより好ましくは、飽和もしくは不飽和 3 から 7 員複素環 R<sup>a</sup> は、アゼチジン - 1 - イル、2 - メチルアゼチジン - 1 - イル、3 - メトキシアゼチジン - 1 - イル、3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル、3 - フルオロアゼチジン - 1 - イル、ピロリジン - 1 - イル、2 - および 3 - フルオロピロリジン - 1 - イル、2, 2 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル、3, 3 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル、2 - および 3 - メチルピロリジン - 1 - イル、2, 2 - ジメチルピロリジン - 1 - イル、3, 3 - ジメチルピロリジン - 1 - イル、2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル、2 - および 3 - トリフルオロメチルピロリジン - 1 - イル、2 - オキソ - オキサゾリジン - 1 - イル、ペペリジン - 1 - イル、2 - メチルペペリジン - 1 - イル、ペペラジン - 1 - イル、4 - メチルペペラジン - 1 - イル、モルホリン - 4 - イル、チオ - モルホリン - 4 - イル、1 - オキソチオモルホリン - 4 - イル、1, 1 - ジオキソチオモルホリン - 4 - イル、ピロール - 1 - イル、ピラゾール - 1 - イル、イミダゾール - 1 - イル、[1, 2, 3] トリアゾール - 1 - イル、[1, 2, 4] トリアゾール - 1 - イル、[1, 2, 3] トリアゾール - 2 - イル、[1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル、[1, 2, 4] トリアゾール - 4 - イル、4 - メチル - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イル、2 - メチル - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - イル、テトラゾール - 1 - イルおよびテトラゾール - 2 - イルなどの窒素原子を介して基 Ar のフェニルまたはピリジル環に結合している窒素含有環から選択される。

10

20

【0089】

別のさらに好ましい実施形態では、飽和もしくは不飽和 3 から 7 員複素環 R<sup>a</sup> は、5 員もしくは 6 員のヘテロ芳香族環であり、その 5 員もしくは 6 員のヘテロ芳香族環は好ましくは、ピロール - 1 - イル、ピロール - 2 - イルもしくはピロール - 3 - イルなどのピロリル、フラン - 2 - イルもしくはフラン - 3 - イルなどのフランル、チエン - 2 - イルもしくはチエン - 3 - イルなどのチエニル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イルもしくはピラゾール - 5 - イルなどのピラゾリル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、イミダゾール - 4 - イルもしくはイミダゾール - 5 - イルなどのイミダゾリル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イルもしくはオキサゾール - 5 - イルなどのオキサゾリル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イルもしくはイソオキサゾール - 5 - イルなどのイソオキサゾリル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イルもしくはチアゾール - 5 - イルなどのチアゾリル、イソチアゾール - 3 - イル、イソチアゾール - 4 - イルもしくはイソチアゾール - 5 - イルなどのイソチアゾリル、[1, 2, 3] - 1H - トリアゾール - 1 - イル、[1, 2, 3] - 1H - トリアゾール - 4 - イル、[1, 2, 3] - 1H - トリアゾール - 5 - イル、[1, 2, 4] - 1H - トリアゾール - 1 - イル、[1, 2, 4] - 1H - トリアゾール - 3 - イル、[1, 2, 4] - 1H - トリアゾール - 5 - イル、[1, 3, 4] - 1H - トリアゾール - 1 - イル、[1, 3, 4] - 1H - トリアゾール - 2 - イル、[1, 3, 4] - 1H - トリアゾール - 5 - イル、[1, 2, 3] - 2H - トリアゾール - 2 - イル、[1, 2, 3] - 2H - トリアゾール - 4 - イルおよび [1, 2, 3] - 2H - トリアゾール - 5 - イルなどのトリアゾリル、[1, 2, 3] オキサジアゾール - 4 - イル、[1, 2, 3] オキサジアゾール - 5 - イル、[1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イル、[1, 2, 4] オキサジアゾール - 5 - イル、[1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イルおよび [1, 3, 4] オキサジアゾール - 5 - イルなどのオキサジアゾリル、[1, 2, 3] チアジアゾール - 4 - イル、[1, 2, 3] チアジアゾール - 5 - イル、[1, 2, 4] チアジアゾール - 3 - イル、[1, 2, 4] チアジアゾール - 5 - イル、[1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イルおよび [1, 3, 4] チアジアゾール - 5 - イルなどのチアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピ

30

40

50

リジン - 3 - イルなどのピリジル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イルなどのピリミジニル、ピラジニルおよびピリダジニルから選択される。

【0090】

好ましくは、5員もしくは6員のヘテロ芳香族環  $R^a$  は、環員としての1個のN原子(5員環では、基  $NR^9$  の形態も可能である。)および場合により環員としてのO、NおよびSから選択される1個もしくは2個の別のヘテロ原子を含み、ピロール - 1 - イル、ピロール - 2 - イルもしくはピロール - 3 - イルなどのピロリル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イルもしくはピラゾール - 5 - イルなどのピラゾリル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、イミダゾール - 4 - イルもしくはイミダゾール - 5 - イルなどのイミダゾリル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イルもしくはオキサゾール - 5 - イルなどのオキサゾリル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イルもしくはイソオキサゾール - 5 - イルなどのイソオキサゾリル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イルもしくはチアゾール - 5 - イルなどのチアゾリル、イソチアゾール - 3 - イル、イソチアゾール - 4 - イルもしくはイソチアゾール - 5 - イルなどのイソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 3 - イルなどのピリジル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イルなどのピリミジニル、ピラジニルおよびピリダジニルなどがある。

10

【0091】

より好ましくは、ヘテロ芳香族環  $R^a$  は5員である。好ましい5員のヘテロ芳香族環は、環員としての1個のN原子(基  $NR^9$  の形態でも可能)および場合によりO、NおよびSから選択される環員としての1個もしくは2個の別のヘテロ原子を含み、例えばピロール - 1 - イル、ピロール - 2 - イルもしくはピロール - 3 - イルなどのピロリル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イルもしくはピラゾール - 5 - イルなどのピラゾリル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、イミダゾール - 4 - イルもしくはイミダゾール - 5 - イルなどのイミダゾリル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イルもしくはオキサゾール - 5 - イルなどのオキサゾリル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イルもしくはイソオキサゾール - 5 - イルなどのイソオキサゾリル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イルもしくはチアゾール - 5 - イルなどのチアゾリル、イソチアゾール - 3 - イル、イソチアゾール - 4 - イルもしくはイソチアゾール - 5 - イルなどのイソチアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリルおよびチアジアゾリルなどがある。特に好ましい5員ヘテロ芳香族環は、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イルなどのチアゾリル、または具体的にはチアゾール - 5 - イルである。

20

30

【0092】

好ましくは、5員もしくは6員のヘテロ芳香族環  $R^a$  は非置換であり、またはハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - チオアルキル、フッ素化  $C_1 - C_4$  - チオアルキルおよびアミノ -  $C_1 - C_2$  - アルキレンから選択される1個、2個もしくは3個、好ましくは1個の置換基を有する。

40

【0093】

好ましい実施形態において、 $R^a$  は、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - ヒドロキシアルキル、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、フッ素化  $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_2 - C_4$  - アルケニル、フッ素化  $C_2 - C_4$  - アルケニル、 $NR^6R^7$ 、 $ONR^6R^7$ 、 $C_1 - C_6$  - アルキレン -  $NR^6R^7$  ( $R^6$  および  $R^7$  は互いに独立にH、 $C_1 - C_4$  - アルキルもしくは  $C_1 - C_4$  - アルコキシである。)、ウレイド( $NHCONH_2$ )  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、フッ素化  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、アセチル、カルボキシル、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、ベンゾオキシ、メチルスルファニル、フルオロ - メチルスルファニル、ジフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルファニル、メチルスルホニルおよび上記の飽和もしくは不飽和の3から

50

7員複素環のいずれか、特にアゼチジン - 1 - イル、2 - メチルアゼチジニル、3 - メトキシアゼチジニル、3 - ヒドロキシアゼチジニル、3 - フルオロアゼチジニル、ピロリジン - 1 - イル、ピロリジン - 2 - イル、ピロリジン - 3 - イル、2 - および 3 - フルオロピロリジン - 1 - イル、2, 2 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル、3, 3 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル、2 - および 3 - メチルピロリジン - 1 - イル、1 - メチルピロリジン - 2 - イル、2, 2 - ジメチルピロリジン - 1 - イル、3, 3 - ジメチルピロリジン - 1 - イル、2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル、2 - および 3 - トリフルオロメチルピロリジン - 1 - イル、2 - オキソ - オキサゾリジン - 1 - イル、ペペリジン - 1 - イル、2 - メチルペペリジン - 1 - イル、ペペラジン - 1 - イル、4 - メチルペペラジン - 1 - イル、モルホリン - 4 - イル、チオ - モルホリン - 4 - イル、1 - オキソチオモルホリン - 4 - イル、1, 1 - ジオキソチオモルホリン - 4 - イル、ピロール - 1 - イル、ピロール - 2 - イル、ピロール - 3 - イル、1 - メチルピロール - 2 - イル、1 - メチルピロール - 3 - イル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イル、1 - メチルピラゾール - 4 - イル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、1 - メチルイミダゾール - 2 - イル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イル、チアゾール - 5 - イル、2 - メチルチアゾール - 4 - イル、[ 1, 2, 3 ] トリアゾール - 1 - イル、[ 1, 2, 4 ] トリアゾール - 1 - イル、[ 1, 2, 3 ] トリアゾール - 2 - イル、[ 1, 2, 4 ] トリアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 4 ] トリアゾール - 4 - イル、4 - メチル - [ 1, 2, 4 ] トリアゾール - 3 - イル、2 - メチル - [ 1, 2, 3 ] トリアゾール - 4 - イル、[ 1, 3, 4 ] - オキサジアゾール - 2 - イル、[ 1, 2, 4 ] - オキサジアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 4 ] - オキサジアゾール - 5 - イル、[ 1, 2, 3 ] - オキサジアゾール - 5 - イル、[ 1, 3, 4 ] - オキサジアゾール - 2 - イル、5 - メチル - [ 1, 3, 4 ] - オキサジアゾール - 2 - イル、5 - メチル - [ 1, 2, 4 ] - オキサジアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 3 ] チアジアゾール - 4 - イル、テトラゾール - 1 - イル、テトラゾール - 5 - イル、2 - メチルテトラゾール - 5 - イル、1 - メチルテトラゾール - 5 - イル、フラザン - 3 - イル、ピリド - 2 - イル、ピリド - 3 - イル、ピリド - 4 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イルおよび 2 - メチルピリミジン - 4 - イルからなる群から選択される。

10

20

30

40

50

【 0 0 9 4 】

より好ましい実施形態において、R<sup>a</sup> は、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、フッ素化 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、OCF<sub>3</sub>、OCHF<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>F、2 - フルオロエトキシ、2, 2 - ジフルオロエトキシ、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ、1, 1, 2, 2, 2 - ペンタフルオロエトキシ、C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルケニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、フッ素化 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、ウレイド、アセチル、アセチルアミノ、カルボキシル、ヒドロキシ、シアノ、ニトロ、ベンゾオキシ、トリフルオロ - メチルスルファニル、メチルスルホニル、アゼチジン - 1 - イル、2 - メチルアゼチジニル、3 - メトキシアゼチジニル、3 - ヒドロキシアゼチジニル、3 - フルオロアゼチジニル、2, 2 - ジフルオロアゼチジン - 1 - イル、ピロリジン - 1 - イル、ピロリジン - 2 - イル、ピロリジン - 3 - イル、2 - および 3 - フルオロピロリジン - 1 - イル、2, 2 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル、3, 3 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル、2 - および 3 - メチルピロリジン - 1 - イル、1 - メチルピロリジン - 2 - イル、2, 2 - ジメチルピロリジン - 1 - イル、3, 3 - ジメチルピロリジン - 1 - イル、2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル、2 - および 3 - トリフルオロメチルピロリジン - 1 - イル、2 - オキソ - オキサゾリジン - 1 - イル、ペペリジン - 1 - イル、2 - メチルペペリジン - 1 - イル、2 - フルオロペペリジン - 1 - イル、2, 2 - ジフルオロペペリジン - 1 - イル、ペペラジン - 1 - イル、4 - メチルペペラジン - 1 - イル、モルホリン - 4 - イル、チオモルホリン - 4 - イル、1 - オキソチオモルホリン - 4 - イル、1, 1 - ジオキソチオモルホリン - 4 - イル、ピロール - 1 - イル、

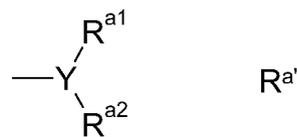
ピロール - 2 - イル、ピロール - 3 - イル、1 - メチルピロール - 2 - イル、1 - メチルピロール - 3 - イル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イル、1 - メチルピラゾール - 4 - イル、4 - フルオロピラゾール - 1 - イル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、1 - メチルイミダゾール - 2 - イル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イル、チアゾール - 5 - イル、2 - メチルチアゾール - 4 - イル、2 - メチルチアゾール - 5 - イル、[ 1, 2, 3 ] トリアゾール - 1 - イル、[ 1, 2, 4 ] トリアゾール - 1 - イル、[ 1, 2, 3 ] トリアゾール - 2 - イル、[ 1, 2, 4 ] トリアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 4 ] トリアゾール - 4 - イル、4 - メチル - [ 1, 2, 4 ] トリアゾール - 3 - イル、2 - メチル - [ 1, 2, 3 ] トリアゾール - 4 - イル、[ 1, 3, 4 ] - オキサジアゾール - 2 - イル、[ 1, 2, 4 ] - オキサジアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 4 ] - オキサジアゾール - 5 - イル、[ 1, 2, 3 ] - オキサジアゾール - 5 - イル、[ 1, 3, 4 ] - オキサジアゾール - 2 - イル、5 - メチル - [ 1, 3, 4 ] - オキサジアゾール - 2 - イル、5 - メチル - [ 1, 2, 4 ] - オキサジアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 3 ] チアジアゾール - 4 - イル、[ 1, 2, 3 ] チアジアゾール - 5 - イル、[ 1, 2, 4 ] チアジアゾール - 3 - イル、[ 1, 2, 4 ] チアジアゾール - 5 - イル、[ 1, 3, 4 ] チアジアゾール - 2 - イル、テトラゾール - 1 - イル、テトラゾール - 5 - イル、2 - メチルテトラゾール - 5 - イル、1 - メチルテトラゾール - 5 - イル、フラザン - 3 - イル、ピリド - 2 - イル、ピリド - 3 - イル、ピリド - 4 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イルおよび 2 - メチルピリミジン - 4 - イルからなる群から選択される。

【 0 0 9 5 】

別途に好ましい実施形態では、 $R^a$  は下記式  $R^a$  を有する。

【 0 0 9 6 】

【 化 7 】



式中、

Y は、N、CH または CF であり、

$R^{a1}$  および  $R^{a2}$  は互いに独立に、 $C_1 - C_2$  - アルキル、特にメチル、フッ素化  $C_1 - C_2$  - アルキル、特にフルオロメチル、ジフルオロメチルまたはトリフルオロメチルから選択される、ただし Y が CH または CF である場合、基  $R^{a1}$  または  $R^{a2}$  のうちの一方は水素またはフッ素であることもでき、あるいは

$R^{a1}$  および  $R^{a2}$  が、基  $(CH_2)_m$  (その水素原子のうちの 1 個もしくは 2 個がフッ素によって置き換わっていても良く、m は 2、3 または 4 である。)、特に  $CH_2 - CH_2$ 、 $CHF - CH_2$ 、 $CF_2 - CH_2$ 、 $CH_2 - CH_2 - CH_2$ 、 $CHF - CH_2 - CH_2$ 、 $CF_2 - CH_2 - CH_2$ 、 $CH_2 - CHF - CH_2$ 、 $CH_2 - CF_2 - CH_2$  を形成している。

【 0 0 9 7 】

$R^{a1}$  および  $R^{a2}$  が互いに異なる場合、上記式  $R^a$  の基は、Y 部分に関して (R) 配置もしくは (S) 配置を有することができる。

【 0 0 9 8 】

式  $R^a$  の好ましい基の例には、イソプロピル、(R) - 1 - フルオロエチル、(S) - 1 - フルオロエチル、2 - フルオロエチル、1, 1 - ジフルオロエチル、2, 2 - ジフルオロエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、(R) - 1 - フルオロプロピル、(S) - 1 - フルオロプロピル、2 - フルオロプロピル、3 - フルオロプロピル、1, 1 - ジ

フルオロプロピル、2, 2 - ジフルオロプロピル、3, 3 - ジフルオロプロピル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、シクロプロピル、シクロブチル、1 - フルオロシクロプロピル、(S) - および (R) - 2, 2 - ジフルオロシクロプロピルおよび 2 - フルオロシクロプロピルが含まれる。

【0099】

式 R<sup>a</sup> の基の中では、1, 2, 3 もしくは 4 個、特に 1, 2 もしくは 3 個のフッ素原子を有するものが好ましい。

【0100】

Ar についての好ましい例は、特に 3 - メチルフェニル、3 - エチルフェニル、3 - プロピルフェニル、3 - イソプロピルフェニル、3 - sec - ブチルフェニル、3 - イソブチルフェニル、3 - tert - ブチルフェニル、3 - (1, 1 - ジメチルプロピル) - フェニル、3 - ビニルフェニル、3 - イソプロペニルフェニル、2 - フルオロフェニル、3 - フルオロフェニル、3 - クロロフェニル、3 - ブロモフェニル、3 - ヨードフェニル、3 - (フルオロメチル) フェニル、3 - (ジフルオロメチル) フェニル、3 - (トリフルオロメチル) フェニル、3, 5 - ビス(トリフルオロメチル) フェニル、3 - (1 - フルオロエチル) - フェニル、3 - ((S) - 1 - フルオロエチル) - フェニル、3 - ((R) - 1 - フルオロエチル) - フェニル、3 - (2 - フルオロエチル) - フェニル、3 - (1, 1 - ジフルオロエチル) - フェニル、3 - (2, 2 - ジフルオロエチル) - フェニル、3 - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) - フェニル、3 - (3 - フルオロプロピル) - フェニル、3 - (2 - フルオロプロピル) - フェニル、3 - ((S) - 2 - フルオロプロピル) - フェニル、3 - ((R) - 2 - フルオロプロピル) - フェニル、3 - (3, 3 - ジフルオロプロピル) - フェニル、3 - (3, 3, 3 - トリフルオロプロピル) - フェニル、3 - (1 - フルオロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、3 - (2 - フルオロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、3 - ((S) - 2 - フルオロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、3 - ((R) - 2 - フルオロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、3 - (2, 2 - ジフルオロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、3 - ((S) - 2, 2 - ジフルオロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、3 - ((R) - 2, 2 - ジフルオロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、3 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、3 - ((S) - 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、3 - ((R) - 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、3 - (2 - フルオロ - 1 - フルオロメチルエチル) - フェニル、3 - (1 - ジフルオロメチル - 2, 2 - ジフルオロエチル) - フェニル、3 - (1, 1 - ジメチル - 2 - フルオロエチル) - フェニル、3 - メトキシフェニル、3 - エトキシフェニル、3 - プロポキシフェニル、3 - イソプロポキシフェニル、3 - ブトキシフェニル、3 - (フルオロメトキシ) - フェニル、3 - (ジフルオロメトキシ) - フェニル、3 - (トリフルオロメトキシ) - フェニル、3 - (2 - フルオロエトキシ) - フェニル、3 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - フェニル、3 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - フェニル、3 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ) - フェニル、3 - シクロプロピルフェニル、3 - シクロブチルフェニル、3 - シクロペンチルフェニル、3 - (2, 2 - ジフルオロシクロプロピル) - フェニル、3, 4 - ジフルオロフェニル、3, 5 - ジクロロフェニル、2, 3 - ジクロロフェニル、2, 5 - ジクロロフェニル、4 - ブロモ - 3 - フルオロフェニル、3 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル、2 - ブロモ - 3 - フルオロフェニル、3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル、3 - ブロモ - 2, 5 - ジフルオロフェニル、4 - ブロモ - 2, 5 - ジフルオロフェニル、5 - ブロモ - 2, 4 - ジフルオロフェニル、3 - ブロモ - 2, 4 - ジフルオロフェニル、4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) - フェニル、2 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) - フェニル、2 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル) - フェニル、4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) - フェニル、3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル) - フェニル、4 - ブロモ - 3 - (トリフルオロメチル) - フェニル、3 - ブロモ - 5 - (トリフルオロメチル) - フェニル、2 - ブロモ - 5 - (トリフルオロメチル) - フェニル、5 - ブロモ - 2 - メトキシフェニル、3 - ブロモ - 4 - メトキシフェニル、3 - ブロモ - 4

- (トリフルオロメトキシ) - フェニル、3, 5 - ジブromo - 4 - (2 - フルオロエトキシ) - フェニル、2 - フルオロ - 3 - イソプロピルフェニル、4 - フルオロ - 3 - イソプロピルフェニル、3 - (1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル) - フェニル、3 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - フェニル、3 - アセチルフェニル、3 - アセチルアミノフェニル、3 - カルボキシフェニル、3 - シアノフェニル、3 - ニトロフェニル、3 - ヒドロキシフェニル、3 - (O - ベンジル) - フェニル、3 - (2 - メトキシエトキシ) - フェニル、3 - (CH<sub>2</sub> - N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>) - フェニル、3 - (NH - CO - NH<sub>2</sub>) - フェニル、3 - (メチルスルファニル) - フェニル、3 - (フルオロメチルスルファニル) - フェニル、3 - (ジフルオロメチルスルファニル) - フェニル、3 - (トリフルオロメチルスルファニル) - フェニル、3 - (メチルスルホニル) - フェニル、3 - (N - 10  
 メトキシ - N - メチル - アミノ) - フェニル、3 - (メトキシアミノ) - フェニル、3 - (エトキシアミノ) - フェニル、3 - (N - メチルアミノオキシ) - フェニル、3 - (N, N - ジメチルアミノオキシ) - フェニル、3 - シアノフェニル、2, 5 - ジメチルフェニル、2, 5 - ジ - (トリフルオロメチル) - フェニル、3, 5 - ジ - (トリフルオロメチル) - フェニル、2, 5 - ジメトキシフェニル、2 - メトキシ - 5 - メチルフェニル、2 - メトキシ - 5 - (トリフルオロメチル) - フェニル、3 - (アゼチジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (2 - メチルアゼチジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((S) - 2 - 20  
 メチルアゼチジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((R) - 2 - メチルアゼチジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (3 - フルオロアゼチジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (2, 2 - ジフルオロアゼチジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (3 - メトキシアゼチジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (ピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (ピロリジン - 2 - イル) - フェニル、3 - ((S) - 30  
 ピロリジン - 2 - イル) - フェニル、3 - ((R) - ピロリジン - 2 - イル) - フェニル、3 - (ピロリジン - 3 - イル) - フェニル、3 - ((S) - ピロリジン - 3 - イル) - フェニル、3 - ((R) - ピロリジン - 3 - イル) - フェニル、3 - (ピロリジン - 1 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) - フェニル、5 - (ピロリジン - 1 - イル) - 2 - メトキシフェニル、3 - (ピロリジン - 1 - イル) - 4 - メトキシフェニル、5 - (ピロリジン - 1 - イル) - 2, 4 - ジフルオロフェニル、3 - (ピロリジン - 1 - イル) - 2, 4 - ジフルオロフェニル、3 - (2 - フルオロピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((S) - 2 - フルオロピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((R) - 30  
 2 - フルオロピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (3 - フルオロピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((S) - 3 - フルオロピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((R) - 3 - フルオロピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (2, 2 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (3, 3 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (2 - メチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((S) - 2 - 40  
 メチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((R) - 2 - メチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (3 - メチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((S) - 3 - メチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((R) - 3 - メチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) - フェニル、3 - ((S) - 1 - 40  
 メチルピロリジン - 2 - イル) - フェニル、3 - ((R) - 1 - メチルピロリジン - 2 - イル) - フェニル、3 - (1 - メチルピロリジン - 3 - イル) - フェニル、3 - ((S) - 1 - メチルピロリジン - 3 - イル) - フェニル、3 - ((R) - 1 - メチルピロリジン - 3 - イル) - フェニル、3 - (2, 2 - ジメチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (3, 3 - ジメチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (2 - 40  
 トリフルオロメチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((S) - 2 - トリフルオロメチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((R) - 2 - トリフルオロメチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (3 - トリフルオロメチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((S) - 3 - トリフルオロメチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((R) - 3 - トリフルオロメチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (2 - オキソピロリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (2 - オキソ - オキサゾリジン - 3

10

20

30

40

50

-イル) - フェニル、3 - (ピペリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((S) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((R) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (2 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((S) - 2 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - ((R) - 2 - フルオロピペリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (2, 2 - ジフルオロピペリジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (ピペラジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - フェニル、3 - (モルホリン - 4 - イル) - フェニル、3 - (モルホリン - 4 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) - フェニル、5 - (モルホリン - 4 - イル) - 2 - メトキシフェニル、3 - (モルホリン - 4 - イル) - 4 - メトキシフェニル、5 - (モルホリン - 4 - イル) - 2, 4 - ジフルオロフェニル、3 - (モルホリン - 4 - イル) - 2, 4 - ジフルオロフェニル、3 - (チオモルホリン - 4 - イル) - フェニル、3 - (1 - オキソ - チオモルホリン - 4 - イル) - フェニル、3 - (1, 1 - ジオキソ - チオモルホリン - 4 - イル) - フェニル、3 - (ピロール - 1 - イル) - フェニル、3 - (ピロール - 2 - イル) - フェニル、3 - (ピロール - 3 - イル) - フェニル、3 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) - フェニル、3 - (1 - メチルピロール - 3 - イル) - フェニル、3 - (フラン - 2 - イル) - フェニル、3 - (フラン - 3 - イル) - フェニル、3 - (チオフエン - 2 - イル) - フェニル、3 - (チオフエン - 3 - イル) - フェニル、3 - (5 - プロピルチエン - 2 - イル) - フェニル、3 - (ピラゾール - 1 - イル) - フェニル、3 - (ピラゾール - 3 - イル) - フェニル、3 - (ピラゾール - 4 - イル) - フェニル、3 - (1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル、3 - (1 - エチル - 1H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニル、3 - (1 - メチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル) - フェニル、3 - (4 - フルオロピラゾール - 1 - イル) - フェニル、3 - (1H - イミダゾール - 2 - イル) - フェニル、3 - (イミダゾール - 1 - イル) - フェニル、3 - (1 - メチルイミダゾール - 2 - イル) - フェニル、3 - (オキサゾール - 2 - イル) - フェニル、3 - (オキサゾール - 4 - イル) - フェニル、3 - (オキサゾール - 5 - イル) - フェニル、4 - フルオロ - 3 - (オキサゾール - 4 - イル) - フェニル、3 - (イソオキサゾール - 3 - イル) - フェニル、3 - (イソオキサゾール - 4 - イル) - フェニル、3 - (イソオキサゾール - 5 - イル) - フェニル、3 - (チアゾール - 2 - イル) - フェニル、3 - (チアゾール - 4 - イル) - フェニル、3 - (チアゾール - 5 - イル) - フェニル、3 - (2 - メチルチアゾール - 4 - イル) - フェニル、3 - (2 - メチルチアゾール - 5 - イル) - フェニル、3 - ([1, 2, 3] - トリアゾール - 1 - イル) - フェニル、3 - ([1, 2, 4] - トリアゾール - 1 - イル) - フェニル、3 - ([1, 2, 3] - トリアゾール - 2 - イル) - フェニル、3 - (4H - [1, 2, 4] - トリアゾール - 3 - イル) - フェニル、3 - ([1, 2, 4] - トリアゾール - 4 - イル) - フェニル、3 - (2H - [1, 2, 3] - トリアゾール - 4 - イル) - フェニル、3 - (4 - メチル - 4H - [1, 2, 4] - トリアゾール - 3 - イル) - フェニル、3 - (2 - メチル - 2H - [1, 2, 3] - トリアゾール - 4 - イル) - フェニル、3 - ([1, 3, 4] - オキサジアゾール - 2 - イル) - フェニル、3 - (5 - メチル - [1, 3, 4] - オキサジアゾール - 2 - イル) - フェニル、3 - ([1, 2, 4] - オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル、3 - (5 - メチル - [1, 2, 4] - オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル、3 - ([1, 2, 4] - オキサジアゾール - 5 - イル) - フェニル、3 - ([1, 2, 3] - オキサジアゾール - 4 - イル) - フェニル、3 - ([1, 2, 3] - オキサジアゾール - 5 - イル) - フェニル、3 - ([1, 2, 3] - チアジアゾール - 4 - イル) - フェニル、3 - (1H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル、3 - (テトラゾール - 1 - イル) - フェニル、3 - (2 - メチル - 2H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル、3 - (1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル、3 - フラザン - 3 - イル - フェニル、3 - (ピリド - 2 - イル) - フェニル、3 - (ピリド - 3 - イル) - フェニル、3 - (ピリド - 4 - イル) - フェニル、3 - (ピリミジン - 2 - イル) - フェニル、3 - (ピリミジン - 4 - イル) - フェニル、3 - (2 - メチルピリミ

ジン - 4 - イル) - フェニル、3 - (ピリミジン - 5 - イル) - フェニル、5 - プロモピ  
 リジン - 3 - イル、3 - プロモ - 2 - クロロピリジン - 5 - イル、4 - メチルピリジン -  
 2 - イル、6 - メチルピリジン - 2 - イル、4 - (トリフルオロメチル) - ピリジン - 2  
 - イル、6 - (トリフルオロメチル) - ピリジン - 2 - イル、5 - (トリフルオロメチル  
 ) - ピリジン - 3 - イル、5 - (ピロリジン - 1 - イル) - ピリジン - 3 - イル、3 - (ピ  
 ロリジン - 1 - イル) - 2 - クロロピリジン - 5 - イル、3 - (モルホリン - 4 - イル  
 ) - 2 - クロロピリジン - 5 - イル、4 - メチルフェニル、4 - エチルフェニル、4 - プ  
 ロピルフェニル、4 - イソプロピルフェニル、4 - sec - ブチルフェニル、4 - tert  
 - ブチルフェニル、4 - イソブチルフェニル、4 - (1, 1 - ジメチルプロピル) - フェ  
 ニル、4 - ビニルフェニル、4 - イソプロペニルフェニル、4 - フルオロフェニル、4  
 - クロロフェニル、4 - プロモフェニル、4 - ヨードフェニル、4 - (フルオロメチル)  
 フェニル、4 - (ジフルオロメチル)フェニル、4 - (トリフルオロメチル)フェニル、  
 2, 4 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル、4 - (1 - フルオロエチル) - フェニル  
 、4 - ((S) - 1 - フルオロエチル) - フェニル、4 - ((R) - 1 - フルオロエチル  
 ) - フェニル、4 - (2 - フルオロエチル) - フェニル、4 - (1, 1 - ジフルオロエチ  
 ル) - フェニル、4 - (2, 2 - ジフルオロエチル) - フェニル、4 - (2, 2, 2 - ト  
 リフルオロエチル) - フェニル、4 - (3 - フルオロプロピル) - フェニル、4 - (2 -  
 フルオロプロピル) - フェニル、4 - ((S) - 2 - フルオロプロピル) - フェニル、4  
 - ((R) - 2 - フルオロプロピル) - フェニル、4 - (3, 3 - ジフルオロプロピル)  
 - フェニル、4 - (3, 3, 3 - トリフルオロプロピル) - フェニル、4 - (1 - フルオ  
 ロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、4 - (2 - フルオロ - 1 - メチルエチル) - フェ  
 ニル、4 - ((S) - 2 - フルオロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、4 - ((R) - 2 -  
 フルオロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、4 - (2, 2 - ジフルオロ - 1 - メチルエチ  
 ル) - フェニル、4 - ((S) - 2, 2 - ジフルオロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、  
 4 - ((R) - 2, 2 - ジフルオロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、4 - (2, 2, 2  
 - トリフルオロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、4 - ((S) - 2, 2, 2 - トリフル  
 オロ - 1 - メチルエチル) - フェニル、4 - ((R) - 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 -  
 メチルエチル) - フェニル、4 - (2 - フルオロ - 1 - フルオロメチルエチル) - フェ  
 ニル、4 - (1 - ジフルオロメチル - 2, 2 - ジフルオロエチル) - フェニル、4 - (1,  
 1 - ジメチル - 2 - フルオロエチル) - フェニル、4 - メトキシフェニル、4 - エトキシ  
 フェニル、4 - プロポキシフェニル、4 - イソプロポキシフェニル、4 - ブトキシフェ  
 ニル、4 - (フルオロメトキシ) - フェニル、4 - (ジフルオロメトキシ) - フェニル、4  
 - (トリフルオロメトキシ) - フェニル、4 - (2 - フルオロエトキシ) - フェニル、4  
 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - フェニル、4 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキ  
 シ) - フェニル、4 - (1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ) - フェニル、4 - シ  
 クロプロピルフェニル、4 - シクロブチルフェニル、4 - シクロペンチルフェニル、4 -  
 (2, 2 - ジフルオロシクロプロピル) - フェニル、3, 4 - ジフルオロフェニル、4 -  
 プロモ - 2 - フルオロフェニル、2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル、4 - プロモ - 2,  
 5 - ジフルオロフェニル、5 - プロモ - 2, 4 - ジフルオロフェニル、3 - プロモ - 2,  
 4 - ジフルオロフェニル、3 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル) - フェニル、4 - フ  
 ルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) - フェニル、3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメ  
 チル) - フェニル、3 - プロモ - 4 - (トリフルオロメチル) - フェニル、5 - プロモ -  
 3 - (トリフルオロメチル) - フェニル、5 - プロモ - 2 - (トリフルオロメチル) - フェ  
 ニル、2 - プロモ - 5 - メトキシフェニル、4 - プロモ - 3 - メトキシフェニル、3 -  
 フルオロ - 2 - イソプロピルフェニル、3 - フルオロ - 4 - イソプロピルフェニル、4 -  
 (1 - ヒドロキシ - 1 - メチルエチル) - フェニル、4 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチル  
 プロピル) - フェニル、4 - アセチルフェニル、4 - アセチルアミノフェニル、4 - カル  
 ボキシフェニル、4 - シアノフェニル、4 - ニトロフェニル、4 - ヒドロキシフェニル、  
 4 - (O - ベンジル) - フェニル、4 - (2 - メトキシエトキシ) - フェニル、4 - (C  
 H<sub>2</sub> - N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>) - フェニル、4 - (NH - CO - NH<sub>2</sub>) - フェニル、4 - (メ

10

20

30

40

50

チルスルファニル) - フェニル、4 - (フルオロメチルスルファニル) - フェニル、4 -  
 (ジフルオロメチルスルファニル) - フェニル、4 - (トリフルオロメチルスルファニル  
 ) - フェニル、4 - (メチルスルホニル) - フェニル、4 - (N - メトキシ - N - メチル  
 - アミノ) - フェニル、4 - (メトキシアミノ) - フェニル、4 - (エトキシアミノ) -  
 フェニル、4 - (N - メチルアミノオキシ) - フェニル、4 - (N, N - ジメチルアミノ  
 オキシ) - フェニル、4 - (アゼチジン - 1 - イル) - フェニル、4 - (2 - メチルアゼ  
 チジン - 1 - イル) - フェニル、4 - ((S) - 2 - メチルアゼチジン - 1 - イル) - フェ  
 ニル、4 - ((R) - 2 - メチルアゼチジン - 1 - イル) - フェニル、4 - (3 - フル  
 オロアゼチジン - 1 - イル) - フェニル、4 - (3 - メトキシアゼチジン - 1 - イル) -  
 フェニル、4 - (3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル) - フェニル、4 - (ピロリジン 10  
 - 1 - イル) - フェニル、4 - (ピロリジン - 2 - イル) - フェニル、4 - ((S) - ピ  
 ロリジン - 2 - イル) - フェニル、4 - ((R) - ピロリジン - 2 - イル) - フェニル、  
 4 - (ピロリジン - 3 - イル) - フェニル、4 - ((S) - ピロリジン - 3 - イル) - フェ  
 ニル、4 - ((R) - ピロリジン - 3 - イル) - フェニル、4 - (ピロリジン - 1 - イ  
 ル) - 5 - (トリフルオロメチル) - フェニル、4 - (ピロリジン - 1 - イル) - 2 - メ  
 トキシフェニル、4 - (ピロリジン - 1 - イル) - 3 4 - メトキシフェニル、4 - (ピロ  
 リジン - 1 - イル) - 2, 5 - ジフルオロフェニル、4 - (ピロリジン - 1 - イル) - 2  
 , 6 - ジフルオロフェニル、4 - (2 - フルオロピロリジン - 1 - イル) - フェニル、4  
 - ((S) - 2 - フルオロピロリジン - 1 - イル) - フェニル、4 - ((R) - 2 - フル  
 オロピロリジン - 1 - イル) - フェニル、4 - (3 - フルオロピロリジン - 1 - イル) -  
 フェニル、4 - ((S) - 3 - フルオロピロリジン - 1 - イル) - フェニル、4 - ((R)  
 ) - 3 - フルオロピロリジン - 1 - イル) - フェニル、4 - (2, 2 - ジフルオロピロリ  
 ジン - 1 - イル) - フェニル、4 - (3, 3 - ジフルオロピロリジン - 1 - イル) - フェ  
 ニル、4 - (2 - メチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、4 - ((S) - 2 - メチル  
 ピロリジン - 1 - イル) - フェニル、4 - ((R) - 2 - メチルピロリジン - 1 - イル)  
 - フェニル、4 - (3 - メチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、4 - ((S) - 3 -  
 メチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、4 - ((R) - 3 - メチルピロリジン - 1 -  
 イル) - フェニル、4 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) - フェニル、4 - ((S)  
 - 1 - メチルピロリジン - 2 - イル) - フェニル、4 - ((R) - 1 - メチルピロリジン  
 - 2 - イル) - フェニル、4 - (1 - メチルピロリジン - 3 - イル) - フェニル、4 - ( 30  
 (S) - 1 - メチルピロリジン - 3 - イル) - フェニル、4 - ((R) - 1 - メチルピロ  
 リジン - 3 - イル) - フェニル、4 - (2, 2 - ジメチルピロリジン - 1 - イル) - フェ  
 ニル、4 - (3, 3 - ジメチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、4 - (2 - トリフル  
 オロメチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、4 - ((S) - 2 - トリフルオロメチル  
 ピロリジン - 1 - イル) - フェニル、4 - ((R) - 2 - トリフルオロメチルピロリジン  
 - 1 - イル) - フェニル、4 - (3 - トリフルオロメチルピロリジン - 1 - イル) - フェ  
 ニル、4 - ((S) - 3 - トリフルオロメチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、4 -  
 ((R) - 3 - トリフルオロメチルピロリジン - 1 - イル) - フェニル、4 - (2 - オキ  
 ソピロリジン - 1 - イル) - フェニル、4 - (2 - オキソ - オキサゾリジン - 3 - イル)  
 - フェニル、4 - (ピペリジン - 1 - イル) - フェニル、4 - (2 - メチルピペリジン - 40  
 1 - イル) - フェニル、4 - ((S) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - フェニル、  
 4 - ((R) - 2 - メチルピペリジン - 1 - イル) - フェニル、4 - (ピペラジン - 1 -  
 イル) - フェニル、4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - フェニル、4 - (モルホ  
 リン - 4 - イル) - フェニル、4 - (モルホリン - 4 - イル) - 5 - (トリフルオロメチ  
 ル) - フェニル、4 - (モルホリン - 4 - イル) - 2 - メトキシフェニル、4 - (モルホ  
 リン - 4 - イル) - 3 - メトキシフェニル、4 - (モルホリン - 4 - イル) - 2, 5 - ジ  
 フルオロフェニル、4 - (モルホリン - 4 - イル) - 2, 6 - ジフルオロフェニル、4 -  
 (チオモルホリン - 4 - イル) - フェニル、4 - (1 - オキソ - チオモルホリン - 4 - イ  
 ル) - フェニル、4 - (1, 1 - ジオキソ - チオモルホリン - 4 - イル) - フェニル、4  
 - (ピロール - 1 - イル) - フェニル、4 - (ピロール - 2 - イル) - フェニル、4 - ( 50

ピロール - 3 - イル) - フェニル、4 - (1 - メチルピロール - 2 - イル) - フェニル、  
 4 - (1 - メチルピロール - 3 - イル) - フェニル、4 - (フラン - 2 - イル) - フェニ  
 ル、4 - (フラン - 3 - イル) - フェニル、4 - (チオフェン - 2 - イル) - フェニル、  
 4 - (チオフェン - 3 - イル) - フェニル、4 - (5 - プロピルチエン - 2 - イル) - フ  
 ェニル、4 - (ピラゾール - 1 - イル) - フェニル、4 - (ピラゾール - 3 - イル) - フ  
 ェニル、4 - (ピラゾール - 4 - イル) - フェニル、4 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾー  
 ル - 4 - イル) - フェニル、4 - (1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - フェニ  
 ル、4 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) - フェニル、4 - (1 H - イミダ  
 ザール - 2 - イル) - フェニル、4 - (イミダゾール - 1 - イル) - フェニル、4 - (1  
 - メチルイミダゾール - 2 - イル) - フェニル、4 - (オキサゾール - 2 - イル) - フェ  
 ニル、4 - (オキサゾール - 4 - イル) - フェニル、4 - (オキサゾール - 5 - イル) -  
 フェニル、4 - (イソオキサゾール - 3 - イル) - フェニル、4 - (イソオキサゾール -  
 4 - イル) - フェニル、4 - (イソオキサゾール - 5 - イル) - フェニル、4 - (チアゾ  
 ール - 2 - イル) - フェニル、4 - (チア  
 ザール - 4 - イル) - フェニル、4 - (チアゾール - 5 - イル) - フェニル、4 - (2 -  
 メチルチアゾール - 4 - イル) - フェニル、4 - ([1, 2, 3] - トリアゾール - 1 -  
 イル) - フェニル、4 - ([1, 2, 4] - トリアゾール - 1 - イル) - フェニル、4 -  
 ([1, 2, 3] - トリアゾール - 2 - イル) - フェニル、4 - (4 H - [1, 2, 4]  
 - トリアゾール - 3 - イル) - フェニル、4 - ([1, 2, 4] - トリアゾール - 4 - イ  
 ル) - フェニル、4 - (2 H - [1, 2, 3] - トリアゾール - 4 - イル) - フェニル、  
 4 - (4 - メチル - 4 H - [1, 2, 4] - トリアゾール - 3 - イル) - フェニル、4 -  
 (2 - メチル - 2 H - [1, 2, 3] - トリアゾール - 4 - イル) - フェニル、4 - ([  
 1, 3, 4] - オキサジアゾール - 2 - イル) - フェニル、4 - (5 - メチル - [1, 3  
 , 4] - オキサジアゾール - 2 - イル) - フェニル、4 - ([1, 2, 4] - オキサジア  
 ザール - 3 - イル) - フェニル、4 - (5 - メチル - [1, 2, 4] - オキサジアゾール  
 - 3 - イル) - フェニル、4 - ([1, 2, 4] - オキサジアゾール - 5 - イル) - フェ  
 ニル、4 - ([1, 2, 3] - オキサジアゾール - 4 - イル) - フェニル、4 - ([1,  
 2, 3] - オキサジアゾール - 5 - イル) - フェニル、4 - ([1, 2, 3] - チアジア  
 ザール - 4 - イル) - フェニル、4 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル、4  
 - (テトラゾール - 1 - イル) - フェニル、4 - (2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5  
 - イル) - フェニル、4 - (1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル、  
 4 - フラザン - 3 - イル - フェニル、4 - (ピリド - 2 - イル) - フェニル、4 - (ピリ  
 ド - 3 - イル) - フェニル、4 - (ピリド - 4 - イル) - フェニル、4 - (ピリミジン -  
 2 - イル) - フェニル、4 - (2 - メチルピリミジン - 4 - イル) - フェニル、4 - (ピ  
 リミジン - 4 - イル) - フェニル、4 - (ピリミジン - 5 - イル) - フェニル、4 - プロ  
 モ - 2 - クロロピリジン - 5 - イル、4 - メチルピリジン - 2 - イル、5 - メチルピリジ  
 ン - 2 - イル、4 - (ピロリジン - 1 - イル) - 2 - クロロピリジン - 5 - イル、4 - (モ  
 ルホリン - 4 - イル) - 2 - クロロピリジン - 5 - イル、2 - (モルホリン - 4 - イル  
 ) - ピリジン - 5 - イル、2 - フェノキシピリジン - 5 - イル、チエン - 2 - イル、チエ  
 ン - 3 - イル、3 - クロロチエン - 2 - イル、4 - クロロチエン - 2 - イル、5 - クロロ  
 チエン - 2 - イル、3 - プロモチエン - 2 - イル、4 - プロモチエン - 2 - イル、5 - プ  
 ロモチエン - 2 - イル、4, 5 - ジクロロチエン - 2 - イル、4, 5 - ジプロモチエン -  
 2 - イル、4 - プロモ - 5 - クロロチエン - 2 - イル、3 - プロモ - 5 - クロロチエン -  
 2 - イル、5 - メチルチエン - 2 - イル、5 - エチルチエン - 2 - イル、5 - プロピルチ  
 エン - 2 - イル、5 - トリフルオロメチルチエン - 2 - イル、5 - フェニルチエン - 2 -  
 イル、5 - (ピリド - 2 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (フェニルスルホニル) - チ  
 エン - 2 - イル、4 - (フェニルスルホニル) - チエン - 2 - イル、5 - (ピリド - 2 -  
 イルスルホニル) - チエン - 2 - イル、5 - (3 - クロロ - 5 - トリフルオロ - ピリド -  
 2 - イルスルホニル) - チエン - 2 - イル、5 - (ベンゾイルアミノメチル) - チエン -  
 2 - イル、5 - ((4 - クロロベンゾイル)アミノメチル) - チエン - 2 - イル、5 - (

アセチルアミノメチル) - チエン - 2 - イル、5 - (ピラゾール - 1 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (ピラゾール - 3 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (ピラゾール - 4 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (ピラゾール - 5 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (4 - フルオロピラゾール - 1 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (1 - メチル - 5 - トリフルオロメチル - (1H) - ピラゾール - 3 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - (1H) - ピラゾール - 5 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (4 - カルボキシ - 1 - メチル - 5 - メチルチオ - (1H) - ピラゾール - 3 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (4 - アミノメチル - 1 - メチル - 5 - メチルチオ - (1H) - ピラゾール - 3 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (イソオキサゾール - 3 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (イソオキサゾール - 4 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (イソオキサゾール - 5 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (5 - トリフルオロメチルイソオキサゾール - 3 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (オキサゾール - 2 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (オキサゾール - 4 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (オキサゾール - 5 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (2 - メチルオキサゾール - 4 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (2 - メチルオキサゾール - 5 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (イソチアゾール - 3 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (イソチアゾール - 4 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (イソチアゾール - 5 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (5 - トリフルオロメチルイソチアゾール - 3 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (チアゾール - 2 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (チアゾール - 4 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (チアゾール - 5 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (2 - メチルチアゾール - 4 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (2 - メチルチアゾール - 5 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - ([1, 2, 3] - オキサジアゾール - 4 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - ([1, 2, 3] - チアジアゾール - 4 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (ピリミジン - 2 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (ピリミジン - 4 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (ピリミジン - 5 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - (2 - メチルチオピリミジン - 4 - イル) - チエン - 2 - イル、5 - ([1, 3] - ジオキソラン - 2 - イル) - チエン - 2 - イル、3 - ([1, 3] - ジオキソラン - 2 - イル) - チエン - 2 - イルチエン - 2 - イル、5 - ((3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) - ピリジン - 2 - イル) - メチル) - チエン - 2 - イル、5 - [3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) - ピリド - 2 - イルスルホニル] - チエン - 2 - イル、2 - クロロチエン - 3 - イル、4 - クロロチエン - 3 - イル、5 - クロロチエン - 3 - イル、2 - プロモチエン - 3 - イル、4 - プロモチエン - 3 - イル、5 - プロモチエン - 3 - イル、2, 5 - ジクロロチエン - 3 - イル、2, 5 - ジプロモチエン - 3 - イル、2, 4, 5 - トリクロロチエン - 3 - イル、4 - プロモ - 2, 5 - ジクロロチエン - 3 - イル、2 - クロロ - 5 - メチルスルホニルチエン - 3 - イル、2, 5 - ジメチルチエン - 3 - イル、4 - ヒドロキシチエン - 3 - イル、2 - フェニルチエン - 3 - イル、4 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - チエン - 3 - イル、2 - メトキシカルボニル - 4 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - チエン - 3 - イル、ベンゾ[b]チオフエン - 2 - イル、ベンゾ[b]チオフエン - 3 - イル、3 - メチル - ベンゾ[b]チオフエン - 2 - イル、5 - メチル - ベンゾ[b]チオフエン - 2 - イル、5 - フルオロ - 3 - メチル - ベンゾ[b]チオフエン - 2 - イル、5 - クロロ - 3 - メチル - ベンゾ[b]チオフエン - 2 - イルおよび 5 - プロモ - 3 - メチル - ベンゾ[b]チオフエン - 2 - イルである。

10

20

30

40

50

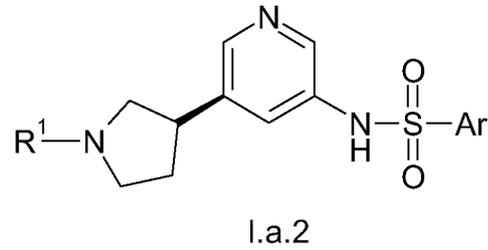
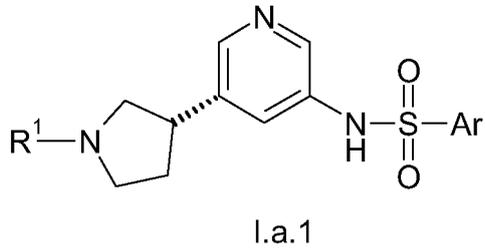
【0101】

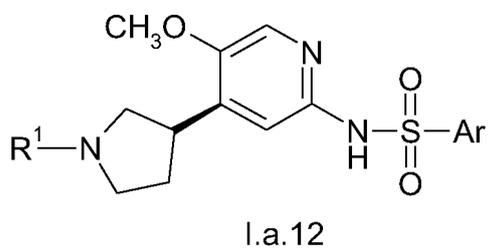
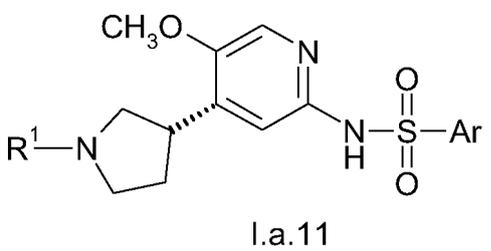
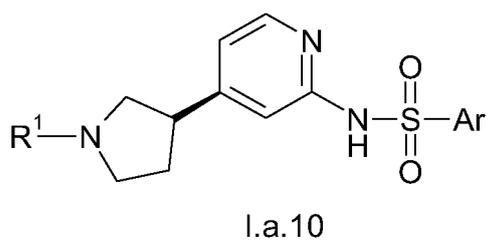
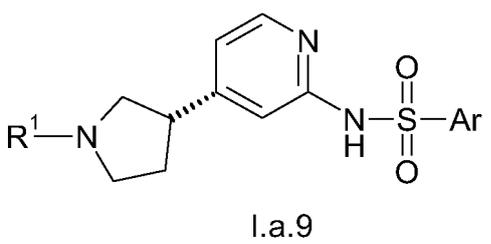
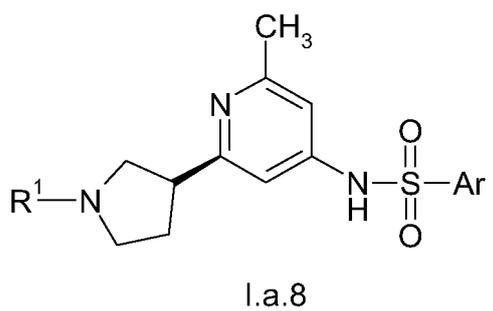
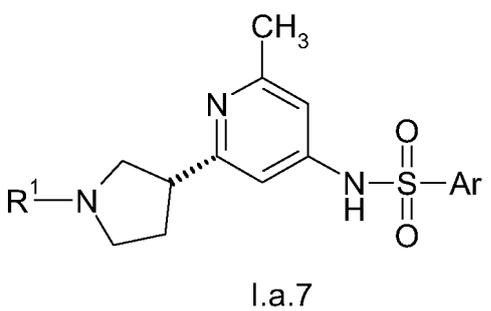
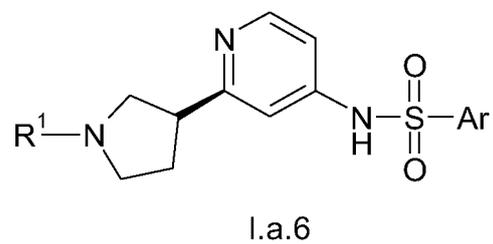
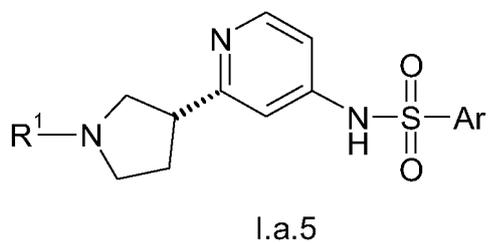
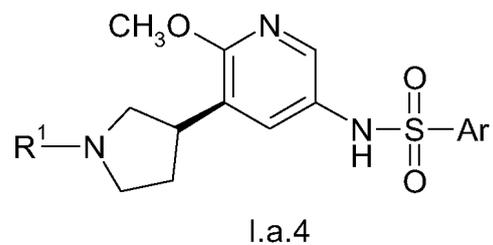
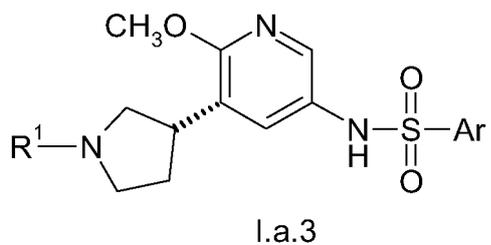
特に好ましい化合物 I は、式 I . a . 1、I . a . 2、I . a . 3、I . a . 4、I . a . 5、I . a . 6、I . a . 7、I . a . 8、I . a . 9、I . a . 10、I . a . 11、I . a . 12、I . a . 13、I . a . 14、I . a . 15、I . a . 16、I . b . 1、I . b . 2、I . b . 3、I . b . 4、I . b . 5、I . b . 6、I . b . 7、I . b . 8、I . b . 9、I . b . 10、I . b . 11、I . b . 12、I . b . 13、I . b . 14、I . b . 15、I . b . 16、I . c . 1、I . c . 2、I . c . 3、I . c . 4、I . c . 5、I . c . 6、I . c . 7、I . c . 8、I . d . 1、I . d . 2、

I . d . 3、I . d . 4、I . d . 5、I . d . 6、I . d . 7、I . d . 8、I . d . 9、I . d . 10、I . d . 11、I . d . 12、I . d . 13、I . d . 14、I . d . 15、I . d . 16、I . d . 17、I . d . 18、I . d . 19、I . d . 20、I . d . 21、I . d . 22、I . d . 23およびI . d . 24のものであり、R<sup>1</sup>およびArは上記で定義の意味を有する。R<sup>1</sup>およびArの好ましい意味は、上記で定義の通りである。

【0102】

【化8】



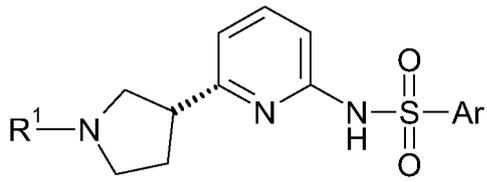


10

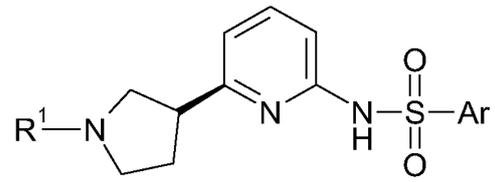
20

30

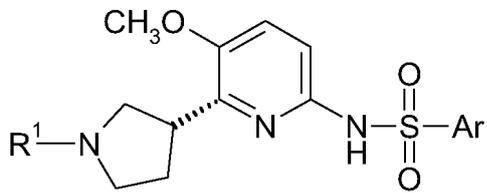
40



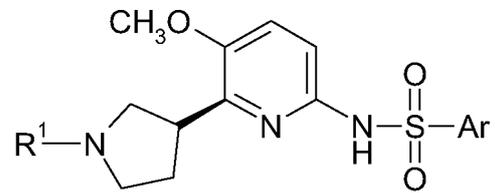
I.a.13



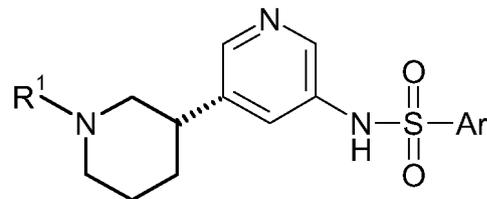
I.a.14



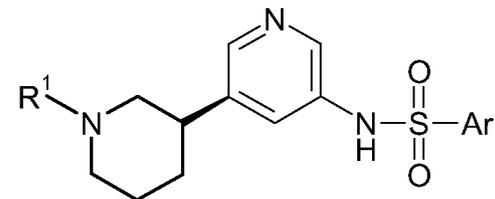
I.a.15



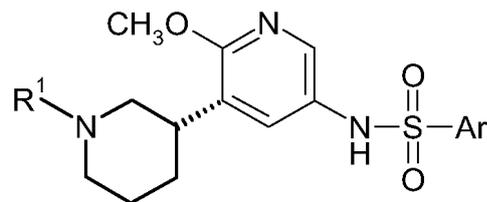
I.a.16



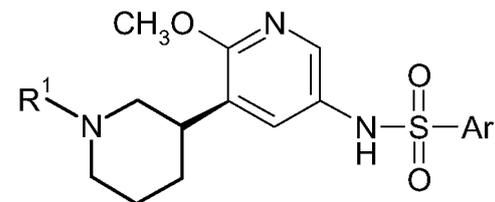
I.b.1



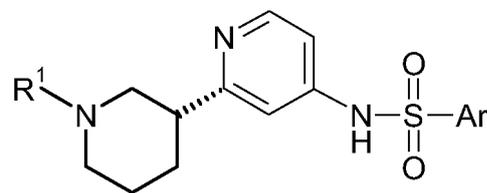
I.b.2



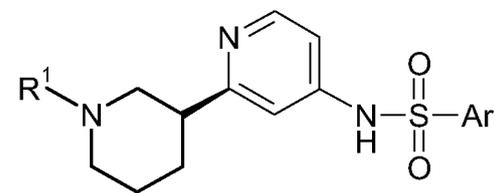
I.b.3



I.b.4



I.b.5



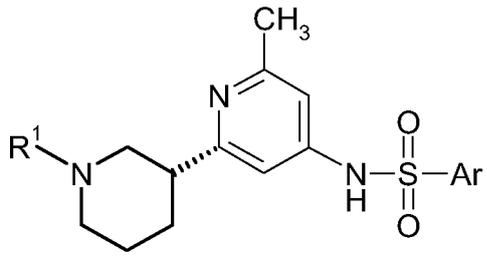
I.b.6

10

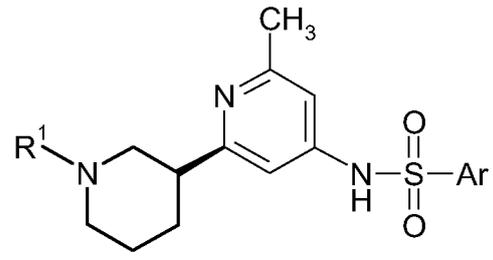
20

30

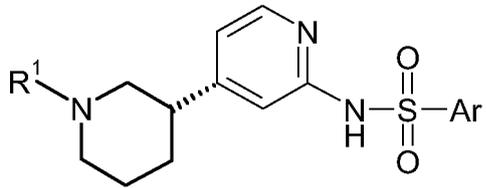
40



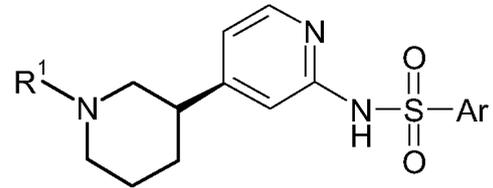
I.b.7



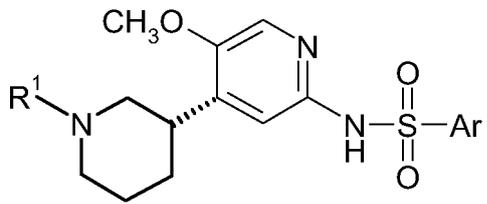
I.b.8



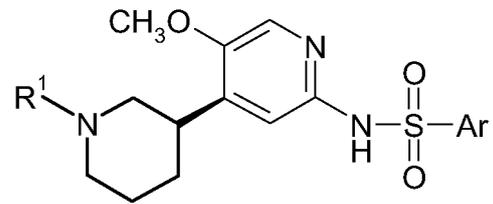
I.b.9



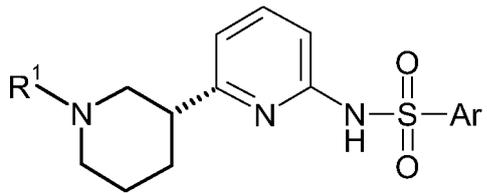
I.b.10



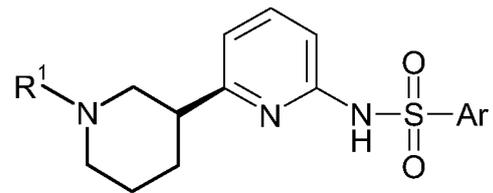
I.b.11



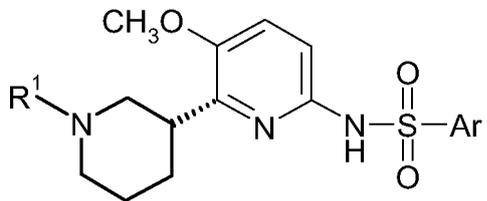
I.b.12



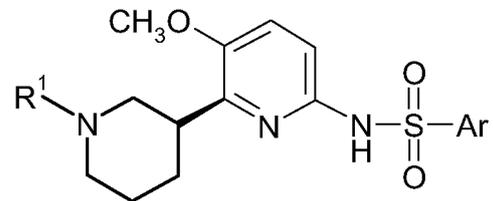
I.b.13



I.b.14



I.b.15



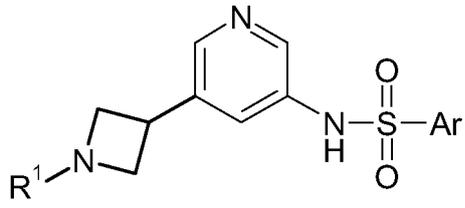
I.b.16

10

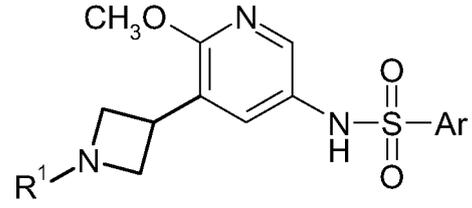
20

30

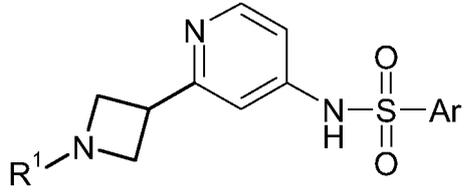
40



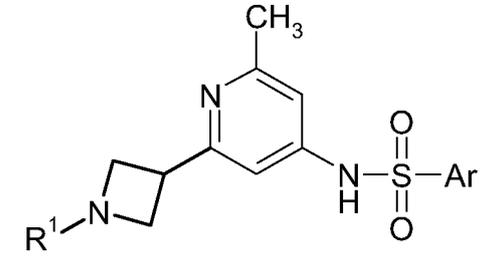
I.c.1



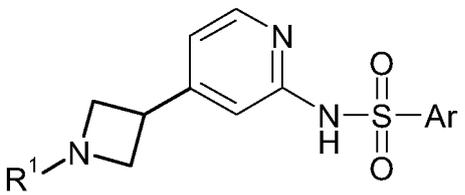
I.c.2



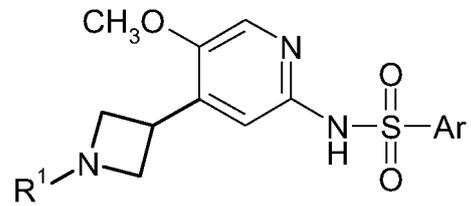
I.c.3



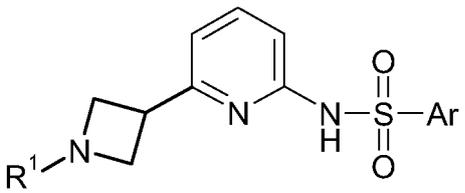
I.c.4



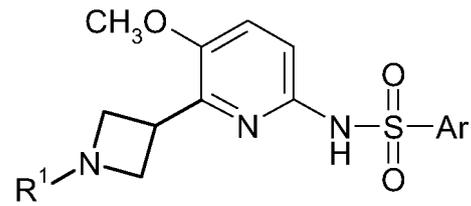
I.c.5



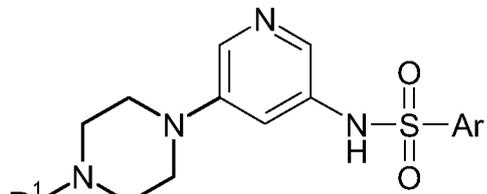
I.c.6



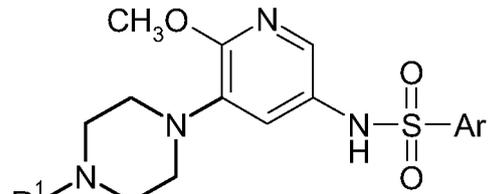
I.c.7



I.c.8



I.d.1



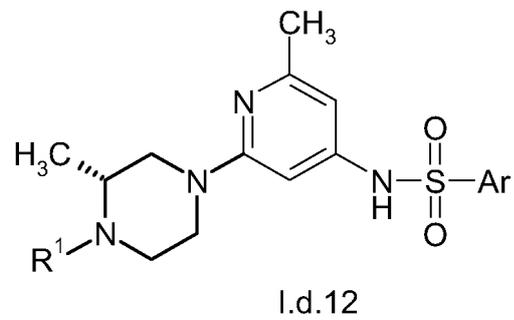
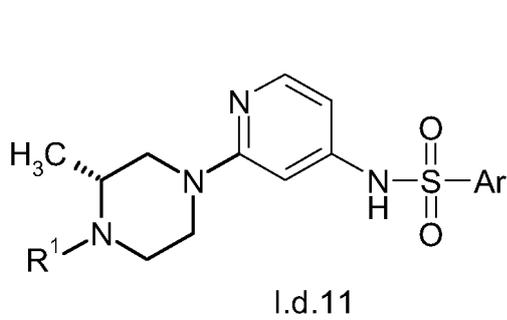
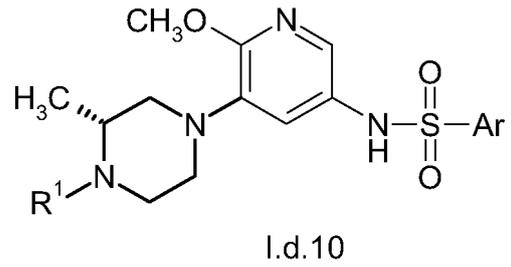
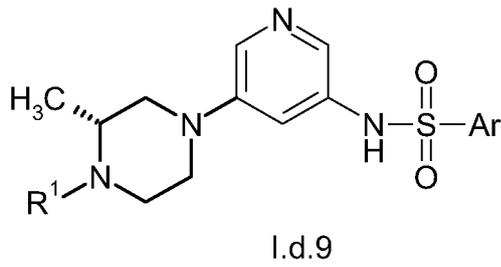
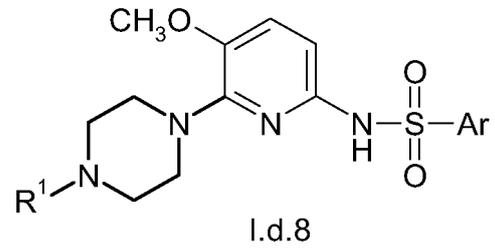
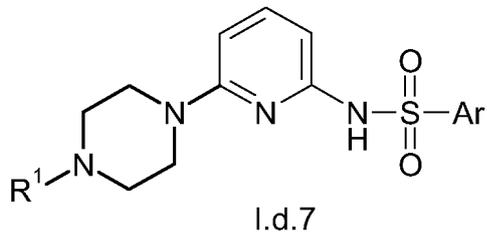
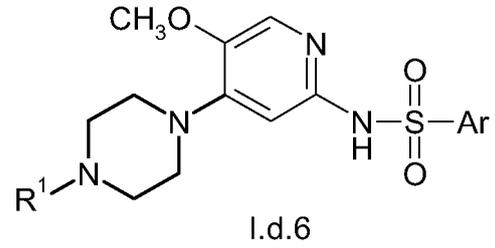
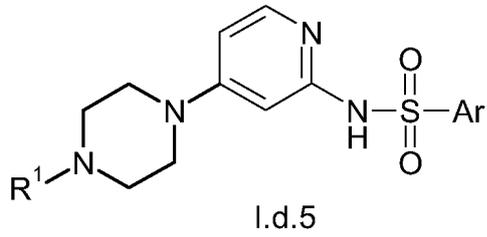
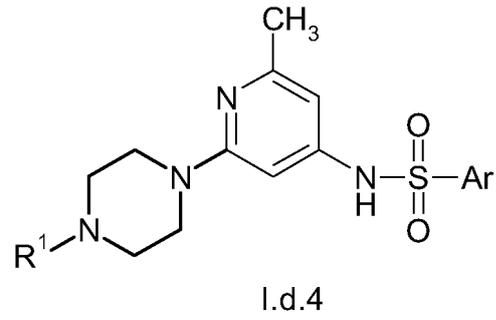
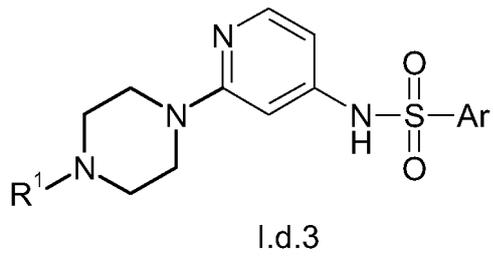
I.d.2

10

20

30

40

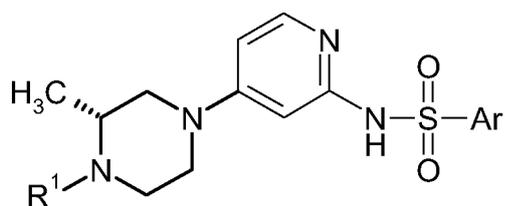


10

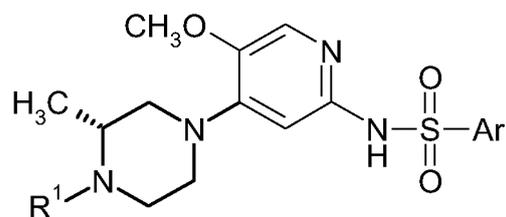
20

30

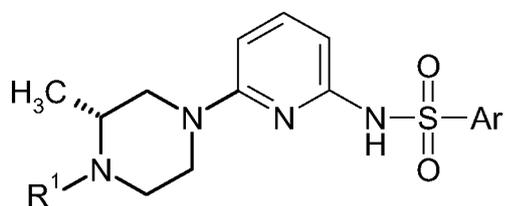
40



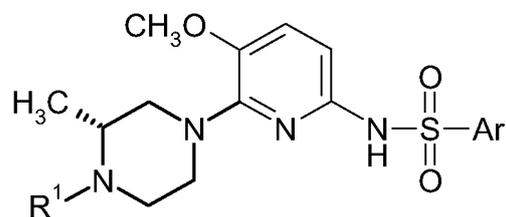
I.d.13



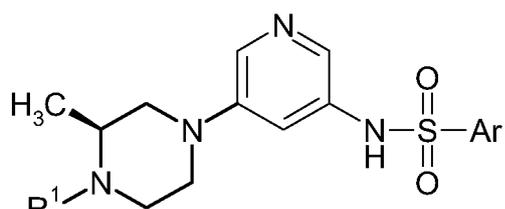
I.d.14



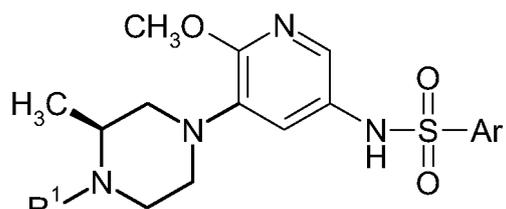
I.d.15



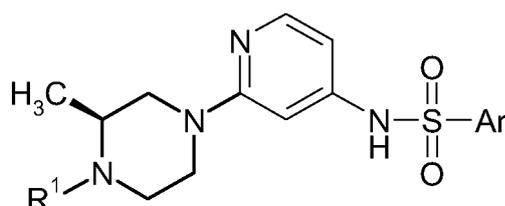
I.d.16



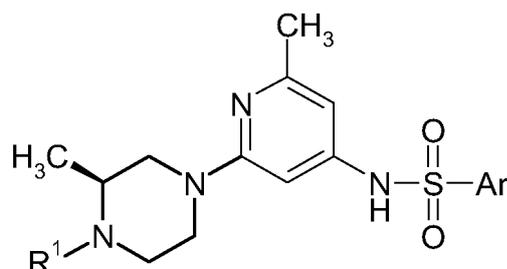
I.d.17



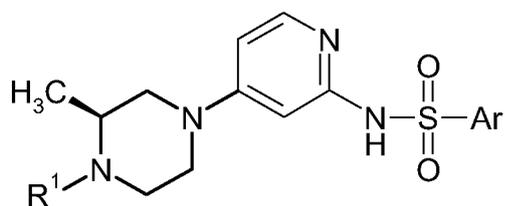
I.d.18



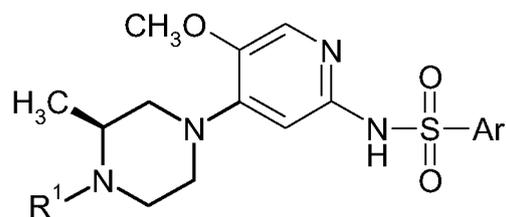
I.d.19



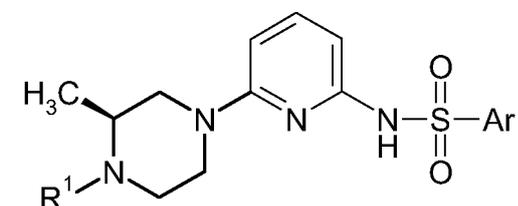
I.d.20



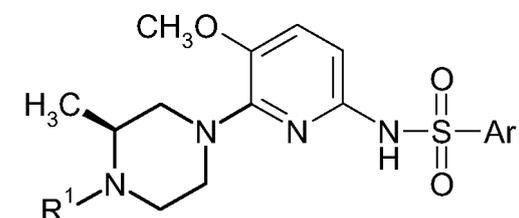
I.d.21



I.d.22



I.d.23



I.d.24

10

20

30

40

50

## 【0103】

式 I . a . 1、I . a . 2、I . a . 3、I . a . 4、I . a . 5、I . a . 6、I . a . 7、I . a . 8、I . a . 9、I . a . 10、I . a . 11、I . a . 12、I . a . 13、I . a . 14、I . a . 15、I . a . 16、I . b . 1、I . b . 2、I . b . 3、I . b . 4、I . b . 5、I . b . 6、I . b . 7、I . b . 8、I . b . 9、I . b . 10、I . b . 11、I . b . 12、I . b . 13、I . b . 14、I . b . 15、I . b . 16、I . c . 1、I . c . 2、I . c . 3、I . c . 4、I . c . 5、I . c . 6、I . c . 7、I . c . 8、I . d . 1、I . d . 2、I . d . 3、I . d . 4、I . d . 5、I . d . 6、I . d . 7、I . d . 8、I . d . 9、I . d . 10、I . d . 11、I . d . 12、I . d . 13、I . d . 14、I . d . 15、I . d . 16、I . d . 17、I . d . 18、I . d . 19、I . d . 20、I . d . 21、I . d . 22、I . d . 23 および I . d . 24 によって表される好ましい化合物の例は、上記で挙げた個々の化合物であり、可変要素 A r および R <sup>1</sup> は下記表 A の一つの列に示した意味を有する。

10

## 【0104】

【表 1】  
表A

No.	R <sup>1</sup>	Ar
1	プロピル	3-メチルフェニル
2	プロピル	3-エチルフェニル
3	プロピル	3-プロピルフェニル
4	プロピル	3-イソプロピルフェニル
5	プロピル	3-sec-ブチルフェニル
6	プロピル	3-tert-ブチルフェニル
7	プロピル	3-イソブチルフェニル
8	プロピル	3-(1,1-ジメチルプロピル)フェニル
9	プロピル	3-ビニルフェニル
10	プロピル	3-イソプロペニルフェニル
11	プロピル	3-フルオロフェニル
12	プロピル	2-フルオロフェニル
13	プロピル	3-クロロフェニル
14	プロピル	3-ブロモフェニル
15	プロピル	3-ヨードフェニル
16	プロピル	3-(フルオロメチル)フェニル
17	プロピル	3-(ジフルオロメチル)フェニル
18	プロピル	3-(トリフルオロメチル)フェニル
19	プロピル	3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル
20	プロピル	3-(1-フルオロエチル)フェニル
21	プロピル	3-((S)-1-フルオロエチル)フェニル
22	プロピル	3-((R)-1-フルオロエチル)フェニル
23	プロピル	3-(2-フルオロエチル)フェニル
24	プロピル	3-(1,1-ジフルオロエチル)フェニル
25	プロピル	3-(2,2-ジフルオロエチル)フェニル
26	プロピル	3-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル
27	プロピル	3-(3-フルオロプロピル)フェニル

10

20

30

40

28	プロピル	3-(2-フルオロプロピル)-フェニル	
29	プロピル	3-((S)-2-フルオロプロピル)-フェニル	
30	プロピル	3-((R)-2-フルオロプロピル)-フェニル	
31	プロピル	3-(3,3-ジフルオロプロピル)-フェニル	
32	プロピル	3-(3,3,3-トリフルオロプロピル)-フェニル	
33	プロピル	3-(1-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
34	プロピル	3-(2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	10
35	プロピル	3-((S)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
36	プロピル	3-((R)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
37	プロピル	3-(2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
38	プロピル	3-((S)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
39	プロピル	3-((R)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	20
40	プロピル	3-(2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
41	プロピル	3-((S)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
42	プロピル	3-((R)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
43	プロピル	3-(2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル)-フェニル	30
44	プロピル	3-(1-ジフルオロメチル-2,2-ジフルオロエチル)-フェニル	
45	プロピル	3-(1,1-ジメチル-2-フルオロエチル)-フェニル	
46	プロピル	3-メトキシフェニル	
47	プロピル	3-エトキシフェニル	
48	プロピル	3-プロポキシフェニル	
49	プロピル	3-イソプロポキシフェニル	40
50	プロピル	3-ブトキシフェニル	
51	プロピル	3-(フルオロメトキシ)-フェニル	

52	プロピル	3-(ジフルオロメトキシ)フェニル
53	プロピル	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル
54	プロピル	3-(2-フルオロエトキシ)フェニル
55	プロピル	3-(2, 2-ジフルオロエトキシ)フェニル
56	プロピル	3-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)フェニル
57	プロピル	3-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェニル
58	プロピル	3-シクロプロピルフェニル
59	プロピル	3-シクロブチルフェニル
60	プロピル	3-シクロペンチルフェニル
61	プロピル	3-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル)フェニル
62	プロピル	3, 4-ジフルオロフェニル
63	プロピル	3-ブロモ-2-フルオロフェニル
64	プロピル	2-ブロモ-3-フルオロフェニル
65	プロピル	3-ブロモ-2, 5-ジフルオロフェニル
66	プロピル	5-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
67	プロピル	3-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
68	プロピル	4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル
69	プロピル	2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
70	プロピル	2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
71	プロピル	4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル
72	プロピル	3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
73	プロピル	4-ブロモ-3-(トリフルオロメチル)フェニル
74	プロピル	3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
75	プロピル	2-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
76	プロピル	5-ブロモ-2-メトキシフェニル
77	プロピル	3-ブロモ-4-メトキシフェニル
78	プロピル	2-フルオロ-2-イソプロピルフェニル
79	プロピル	4-フルオロ-3-イソプロピルフェニル
80	プロピル	3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル
81	プロピル	3-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)フェニル

10

20

30

40

82	プロピル	3-アセチルフェニル
83	プロピル	3-アセチルアミノフェニル
84	プロピル	3-カルボキシフェニル
85	プロピル	3-シアノフェニル
86	プロピル	3-ニトロフェニル
87	プロピル	3-ヒドロキシフェニル
88	プロピル	3-(O-ベンジル)-フェニル
89	プロピル	3-(2-メトキシエトキシ)-フェニル
90	プロピル	3-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-フェニル
91	プロピル	3-(NH-CO-NH <sub>2</sub> )-フェニル
92	プロピル	3-(メチルスルファニル)-フェニル
93	プロピル	3-(フルオロメチルスルファニル)-フェニル
94	プロピル	3-(ジフルオロメチルスルファニル)-フェニル
95	プロピル	3-(トリフルオロメチルスルファニル)-フェニル
96	プロピル	3-(メチルスルホニル)-フェニル
97	プロピル	3-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ)-フェニル
98	プロピル	3-(メトキシアミノ)-フェニル
99	プロピル	3-(エトキシアミノ)-フェニル
100	プロピル	3-(N-メチルアミノオキシ)-フェニル
101	プロピル	3-(N, N-ジメチルアミノオキシ)-フェニル
102	プロピル	3-(アゼチジン-1-イル)-フェニル
103	プロピル	3-(2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
104	プロピル	3-( (S) -2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
105	プロピル	3-( (R) -2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
106	プロピル	3-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)-フェニル
107	プロピル	3-(2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-フェニル
108	プロピル	3-(2-メトキシアゼチジン-1-イル)-フェニル
109	プロピル	3-(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル)-フェニル
110	プロピル	3-(ピロリジン-1-イル)-フェニル
111	プロピル	3-(ピロリジン-2-イル)-フェニル

10

20

30

40

112	プロピル	3-(S)-ピロリジン-2-イル)-フェニル	
113	プロピル	3-(R)-ピロリジン-2-イル)-フェニル	
114	プロピル	3-(ピロリジン-3-イル)-フェニル	
115	プロピル	3-(S)-ピロリジン-3-イル)-フェニル	
116	プロピル	3-(R)-ピロリジン-3-イル)-フェニル	
117	プロピル	3-(ピロリジン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)- フェニル	10
118	プロピル	5-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル	
119	プロピル	3-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル	
120	プロピル	5-(ピロリジン-1-イル)-2,4-ジフルオロフェニル	
121	プロピル	3-(ピロリジン-1-イル)-2,4-ジフルオロフェニル	
122	プロピル	3-(2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
123	プロピル	3-(S)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	20
124	プロピル	3-(R)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
125	プロピル	3-(3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
126	プロピル	3-(S)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
127	プロピル	3-(R)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	30
128	プロピル	3-(2,2-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
129	プロピル	3-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
130	プロピル	3-(2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
131	プロピル	3-(S)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
132	プロピル	3-(R)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
133	プロピル	3-(3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
134	プロピル	3-(S)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	40
135	プロピル	3-(R)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
136	プロピル	3-(1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	

137	プロピル	3-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
138	プロピル	3-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
139	プロピル	3-(1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
140	プロピル	3-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
141	プロピル	3-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
142	プロピル	3-(2,2-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
143	プロピル	3-(3,3-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	10
144	プロピル	3-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
145	プロピル	3-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
146	プロピル	3-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
147	プロピル	3-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	20
148	プロピル	3-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
149	プロピル	3-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
150	プロピル	3-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル	
151	プロピル	3-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル	30
152	プロピル	3-(ピペリジン-1-イル)-フェニル	
153	プロピル	3-(2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
154	プロピル	3-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
155	プロピル	3-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
156	プロピル	3-(2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
157	プロピル	3-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
158	プロピル	3-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	40
159	プロピル	3-(2,2-ジフルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
160	プロピル	3-(ピペラジン-1-イル)-フェニル	

161	プロピル	3-(4-メチルピペラジン-1-イル) -フェニル
162	プロピル	3-(モルホリン-4-イル) -フェニル
163	プロピル	3-(モルホリン-4-イル) -5-(トリフルオロメチル) -フェニル
164	プロピル	5-(モルホリン-4-イル) -2-メトキシフェニル
165	プロピル	3-(モルホリン-4-イル) -4-メトキシフェニル
166	プロピル	5-(モルホリン-4-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル
167	プロピル	3-(モルホリン-4-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル
168	プロピル	3-(チオモルホリン-4-イル) -フェニル
169	プロピル	3-(1-オキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル
170	プロピル	3-(1, 1-ジオキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル
171	プロピル	3-(ピロール-1-イル) -フェニル
172	プロピル	3-(ピロール-2-イル) -フェニル
173	プロピル	3-(ピロール-3-イル) -フェニル
174	プロピル	3-(1-メチルピロール-2-イル) -フェニル
175	プロピル	3-(1-メチルピロール-3-イル) -フェニル
176	プロピル	3-(フラン-2-イル) -フェニル
177	プロピル	3-(フラン-3-イル) -フェニル
178	プロピル	3-(チオフエン-2-イル) -フェニル
179	プロピル	3-(チオフエン-3-イル) -フェニル
180	プロピル	3-(5-プロピルチエン-2-イル) -フェニル
181	プロピル	3-(ピラゾール-1-イル) -フェニル
182	プロピル	3-(ピラゾール-3-イル) -フェニル
183	プロピル	3-(ピラゾール-4-イル) -フェニル
184	プロピル	3-(4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル
185	プロピル	3-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
186	プロピル	3-(1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
187	プロピル	3-(1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) -フェニル
188	プロピル	3-(1H-イミダゾール-2-イル) -フェニル
189	プロピル	3-(イミダゾール-1-イル) -フェニル

10

20

30

40

190	プロピル	3- (1-メチルイミダゾール-2-イル) -フェニル
191	プロピル	3- (オキサゾール-2-イル) -フェニル
192	プロピル	3- (オキサゾール-4-イル) -フェニル
193	プロピル	3- (オキサゾール-5-イル) -フェニル
194	プロピル	3- (イソオキサゾール-3-イル) -フェニル
195	プロピル	3- (イソオキサゾール-4-イル) -フェニル
196	プロピル	3- (イソオキサゾール-5-イル) -フェニル
197	プロピル	3- (チアゾール-2-イル) -フェニル
198	プロピル	3- (チアゾール-4-イル) -フェニル
199	プロピル	3- (チアゾール-5-イル) -フェニル
200	プロピル	3- (2-メチルチアゾール-4-イル) -フェニル
201	プロピル	3- (2-メチルチアゾール-5-イル) -フェニル
202	プロピル	3- ([1, 2, 3] -トリアゾール-1-イル) -フェニル
203	プロピル	3- ([1, 2, 4] -トリアゾール-1-イル) -フェニル
204	プロピル	3- ([1, 2, 3] -トリアゾール-2-イル) -フェニル
205	プロピル	3- (4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル
206	プロピル	3- ([1, 2, 4] -トリアゾール-4-イル) -フェニル
207	プロピル	3- (2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル
208	プロピル	3- (4-メチル-4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル
209	プロピル	3- (2-メチル-2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル
210	プロピル	3- ([1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル
211	プロピル	3- (5-メチル- [1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル
212	プロピル	3- ([1, 2, 4] -オキサジアゾール-3-イル) -フェニル

10

20

30

40

213	プロピル	3-(5-メチル-[1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
214	プロピル	3-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	
215	プロピル	3-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-フェニル	
216	プロピル	3-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	10
217	プロピル	3-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-フェニル	
218	プロピル	3-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
219	プロピル	3-(テトラゾール-1-イル)-フェニル	
220	プロピル	3-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	20
221	プロピル	3-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
222	プロピル	3-フラザン-3-イル-フェニル	
223	プロピル	3-(ピリド-2-イル)-フェニル	
224	プロピル	3-(ピリド-3-イル)-フェニル	
225	プロピル	3-(ピリド-4-イル)-フェニル	
226	プロピル	3-(ピリミジン-2-イル)-フェニル	30
227	プロピル	3-(2-メチルピリミジン-4-イル)-フェニル	
228	プロピル	3-(ピリミジン-4-イル)-フェニル	
229	プロピル	3-(ピリミジン-5-イル)-フェニル	
230	プロピル	5-プロモピリジン-3-イル	
231	プロピル	3-プロモ-2-クロロピリジン-5-イル	
232	プロピル	4-メチルピリジン-2-イル	
233	プロピル	6-メチルピリジン-2-イル	40
234	プロピル	4-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル	
235	プロピル	6-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル	

236	プロピル	5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-3-イル
237	プロピル	5-(ピロリジン-1-イル)-ピリジン-3-イル
238	プロピル	3-(ピロリジン-1-イル)-2-クロロピリジン-5-イル
239	プロピル	3-(モルホリン-4-イル)-2-クロロピリジン-5-イル
240	プロピル	2-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-5-イル
241	プロピル	2-フェノキシピリジン-5-イル
242	プロピル	4-メチルフェニル
243	プロピル	4-エチルフェニル
244	プロピル	4-プロピルフェニル
245	プロピル	4-イソプロピルフェニル
246	プロピル	4-sec-ブチルフェニル
247	プロピル	4-tert-ブチルフェニル
248	プロピル	4-イソブチルフェニル
249	プロピル	4-(1,1-ジメチルプロピル)-フェニル
250	プロピル	4-ビニルフェニル
251	プロピル	4-イソプロペニルフェニル
252	プロピル	4-フルオロフェニル
253	プロピル	4-クロロフェニル
254	プロピル	4-ブロモフェニル
255	プロピル	4-ヨードフェニル
256	プロピル	4-(フルオロメチル)フェニル
257	プロピル	4-(ジフルオロメチル)フェニル
258	プロピル	4-(トリフルオロメチル)フェニル
259	プロピル	2,4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル
260	プロピル	4-(1-フルオロエチル)-フェニル
261	プロピル	4-(S)-1-フルオロエチル)-フェニル
262	プロピル	4-(R)-1-フルオロエチル)-フェニル
263	プロピル	4-(2-フルオロエチル)-フェニル
264	プロピル	4-(1,1-ジフルオロエチル)-フェニル
265	プロピル	4-(2,2-ジフルオロエチル)-フェニル

10

20

30

40

266	プロピル	4-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)-フェニル	
267	プロピル	4-(3-フルオロプロピル)-フェニル	
268	プロピル	4-(2-フルオロプロピル)-フェニル	
269	プロピル	4-(S)-2-フルオロプロピル)-フェニル	
270	プロピル	4-(R)-2-フルオロプロピル)-フェニル	
271	プロピル	4-(3, 3-ジフルオロプロピル)-フェニル	
272	プロピル	4-(3, 3, 3-トリフルオロプロピル)-フェニル	10
273	プロピル	4-(1-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
274	プロピル	4-(2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
275	プロピル	4-(S)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
276	プロピル	4-(R)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
277	プロピル	4-(2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
278	プロピル	4-(S)-2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	20
279	プロピル	4-(R)-2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
280	プロピル	4-(2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
281	プロピル	4-(S)-2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
282	プロピル	4-(R)-2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	30
283	プロピル	4-(2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル)-フェニル	
284	プロピル	4-(1-ジフルオロメチル-2, 2-ジフルオロエチル)-フェニル	
285	プロピル	4-(1, 1-ジメチル-2-フルオロエチル)-フェニル	
286	プロピル	4-メトキシフェニル	
287	プロピル	4-エトキシフェニル	40
288	プロピル	4-プロポキシフェニル	
289	プロピル	4-イソプロポキシフェニル	

290	プロピル	4-ブトキシフェニル
291	プロピル	4-(フルオロメトキシ)フェニル
292	プロピル	4-(ジフルオロメトキシ)フェニル
293	プロピル	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル
294	プロピル	4-(2-フルオロエトキシ)フェニル
295	プロピル	4-(2, 2-ジフルオロエトキシ)フェニル
296	プロピル	4-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)フェニル
297	プロピル	4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェニル
298	プロピル	4-シクロプロピルフェニル
299	プロピル	4-シクロブチルフェニル
300	プロピル	4-シクロペンチルフェニル
301	プロピル	4-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル)フェニル
302	プロピル	3, 4-ジフルオロフェニル
303	プロピル	4-ブロモ-2-フルオロフェニル
304	プロピル	2-ブロモ-4-フルオロフェニル
305	プロピル	4-ブロモ-2, 5-ジフルオロフェニル
306	プロピル	5-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
307	プロピル	3-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
308	プロピル	3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル
309	プロピル	4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル
310	プロピル	3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
311	プロピル	3-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)フェニル
312	プロピル	5-ブロモ-3-(トリフルオロメチル)フェニル
313	プロピル	5-ブロモ-2-(トリフルオロメチル)フェニル
314	プロピル	2-ブロモ-5-メトキシフェニル
315	プロピル	4-ブロモ-3-メトキシフェニル
316	プロピル	3-フルオロ-2-イソプロピルフェニル
317	プロピル	3-フルオロ-4-イソプロピルフェニル
318	プロピル	4-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル
319	プロピル	4-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)フェニル

10

20

30

40

320	プロピル	4-アセチルフェニル
321	プロピル	4-アセチルアミノフェニル
322	プロピル	4-カルボキシフェニル
323	プロピル	4-シアノフェニル
324	プロピル	4-ニトロフェニル
325	プロピル	4-ヒドロキシフェニル
326	プロピル	4-(O-ベンジル)フェニル
327	プロピル	4-(2-メトキシエトキシ)フェニル
328	プロピル	4-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )フェニル
329	プロピル	4-(NH-CO-NH <sub>2</sub> )フェニル
330	プロピル	4-(メチルスルファニル)フェニル
331	プロピル	4-(フルオロメチルスルファニル)フェニル
332	プロピル	4-(ジフルオロメチルスルファニル)フェニル
333	プロピル	4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル
334	プロピル	4-(メチルスルホニル)フェニル
335	プロピル	4-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ)フェニル
336	プロピル	4-(メトキシアミノ)フェニル
337	プロピル	4-(エトキシアミノ)フェニル
338	プロピル	4-(N-メチルアミノオキシ)フェニル
339	プロピル	4-(N, N-ジメチルアミノオキシ)フェニル
340	プロピル	4-(アゼチジン-1-イル)フェニル
341	プロピル	4-(2-メチルアゼチジン-1-イル)フェニル
342	プロピル	4-( (S) -2-メチルアゼチジン-1-イル)フェニル
343	プロピル	4-( (R) -2-メチルアゼチジン-1-イル)フェニル
344	プロピル	4-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)フェニル
345	プロピル	4-(2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル)フェニル
346	プロピル	4-(2-メトキシアゼチジン-1-イル)フェニル
347	プロピル	4-(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル)フェニル
348	プロピル	4-(ピロリジン-1-イル)フェニル
349	プロピル	4-(ピロリジン-2-イル)フェニル

10

20

30

40

350	プロピル	4-((S)-ピロリジン-2-イル)-フェニル	
351	プロピル	3-((R)-ピロリジン-2-イル)-フェニル	
352	プロピル	4-(ピロリジン-3-イル)-フェニル	
353	プロピル	4-((S)-ピロリジン-3-イル)-フェニル	
354	プロピル	4-((R)-ピロリジン-3-イル)-フェニル	
355	プロピル	4-(ピロリジン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)- フェニル	10
356	プロピル	4-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル	
357	プロピル	4-(ピロリジン-1-イル)-3,4-メトキシフェニル	
358	プロピル	4-(ピロリジン-1-イル)-2,5-ジフルオロフェニル	
359	プロピル	4-(ピロリジン-1-イル)-2,6-ジフルオロフェニル	
360	プロピル	4-(2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
361	プロピル	4-((S)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	20
362	プロピル	4-((R)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
363	プロピル	4-(3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
364	プロピル	4-((S)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
365	プロピル	4-((R)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	30
366	プロピル	4-(2,2-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
367	プロピル	4-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
368	プロピル	4-(2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
369	プロピル	4-((S)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
370	プロピル	4-((R)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
371	プロピル	4-(3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
372	プロピル	4-((S)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	40
373	プロピル	4-((R)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
374	プロピル	4-(1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	

375	プロピル	4-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
376	プロピル	4-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
377	プロピル	4-(1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
378	プロピル	4-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
379	プロピル	4-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
380	プロピル	4-(2,2-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
381	プロピル	4-(3,3-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	10
382	プロピル	4-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
383	プロピル	4-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
384	プロピル	4-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
385	プロピル	4-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	20
386	プロピル	4-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
387	プロピル	4-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
388	プロピル	4-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル	
389	プロピル	4-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル	30
390	プロピル	4-(ピペリジン-1-イル)-フェニル	
391	プロピル	4-(2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
392	プロピル	4-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
393	プロピル	4-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
394	プロピル	4-(2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
395	プロピル	4-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
396	プロピル	4-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	40
397	プロピル	4-(2,2-ジフルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
398	プロピル	4-(ピペラジン-1-イル)-フェニル	

399	プロピル	4- (4-メチルピペラジン-1-イル) -フェニル
400	プロピル	4- (モルホリン-4-イル) -フェニル
401	プロピル	4- (モルホリン-4-イル) -5- (トリフルオロメチル) -フェニル
402	プロピル	4- (モルホリン-4-イル) -2-メトキシフェニル
403	プロピル	4- (モルホリン-4-イル) -3-メトキシフェニル
404	プロピル	4- (モルホリン-4-イル) -2, 5-ジフルオロフェニル
405	プロピル	4- (モルホリン-4-イル) -2, 6-ジフルオロフェニル
406	プロピル	4- (チオモルホリン-4-イル) -フェニル
407	プロピル	4- (1-オキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル
408	プロピル	4- (1, 1-ジオキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル
409	プロピル	4- (ピロール-1-イル) -フェニル
410	プロピル	4- (ピロール-2-イル) -フェニル
411	プロピル	4- (ピロール-3-イル) -フェニル
412	プロピル	4- (1-メチルピロール-2-イル) -フェニル
413	プロピル	4- (1-メチルピロール-3-イル) -フェニル
414	プロピル	4- (フラン-2-イル) -フェニル
415	プロピル	4- (フラン-3-イル) -フェニル
416	プロピル	4- (チオフエン-2-イル) -フェニル
417	プロピル	4- (チオフエン-3-イル) -フェニル
418	プロピル	4- (5-プロピルチエン-2-イル) -フェニル
419	プロピル	4- (ピラゾール-1-イル) -フェニル
420	プロピル	4- (ピラゾール-3-イル) -フェニル
421	プロピル	4- (ピラゾール-4-イル) -フェニル
422	プロピル	4- (4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル
423	プロピル	4- (1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
424	プロピル	4- (1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
425	プロピル	4- (1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) -フェニル
426	プロピル	4- (1H-イミダゾール-2-イル) -フェニル
427	プロピル	4- (イミダゾール-1-イル) -フェニル

10

20

30

40

428	プロピル	4- (1-メチルイミダゾール-2-イル) -フェニル
429	プロピル	4- (オキサゾール-2-イル) -フェニル
430	プロピル	4- (オキサゾール-4-イル) -フェニル
431	プロピル	4- (オキサゾール-5-イル) -フェニル
432	プロピル	4- (イソオキサゾール-3-イル) -フェニル
433	プロピル	4- (イソオキサゾール-4-イル) -フェニル
434	プロピル	3- (イソオキサゾール-5-イル) -フェニル
435	プロピル	4- (チアゾール-2-イル) -フェニル
436	プロピル	4- (チアゾール-4-イル) -フェニル
437	プロピル	4- (チアゾール-5-イル) -フェニル
438	プロピル	4- (2-メチルチアゾール-4-イル) -フェニル
439	プロピル	4- (2-メチルチアゾール-5-イル) -フェニル
440	プロピル	4- ( [1, 2, 3] -トリアゾール-1-イル) -フェニル
441	プロピル	4- ( [1, 2, 4] -トリアゾール-1-イル) -フェニル
442	プロピル	4- ( [1, 2, 3] -トリアゾール-2-イル) -フェニル
443	プロピル	4- (4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル
444	プロピル	4- ( [1, 2, 4] -トリアゾール-4-イル) -フェニル
445	プロピル	4- (2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル
446	プロピル	4- (4-メチル-4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル
447	プロピル	4- (2-メチル-2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル
448	プロピル	4- ( [1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル
449	プロピル	4- (5-メチル- [1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル
450	プロピル	4- ( [1, 2, 4] -オキサジアゾール-3-イル) -フェニル

10

20

30

40

451	プロピル	4-(5-メチル-[1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル
452	プロピル	4-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル
453	プロピル	4-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-フェニル
454	プロピル	4-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル
455	プロピル	4-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-フェニル
456	プロピル	4-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル
457	プロピル	4-(テトラゾール-1-イル)-フェニル
458	プロピル	4-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-フェニル
459	プロピル	4-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル
460	プロピル	4-フラザン-3-イル-フェニル
461	プロピル	4-(ピリド-2-イル)-フェニル
462	プロピル	4-(ピリド-3-イル)-フェニル
463	プロピル	4-(ピリド-4-イル)-フェニル
464	プロピル	4-(ピリミジン-2-イル)-フェニル
465	プロピル	4-(2-メチルピリミジン-4-イル)-フェニル
466	プロピル	4-(ピリミジン-4-イル)-フェニル
467	プロピル	4-(ピリミジン-5-イル)-フェニル
468	プロピル	5-ブロモピリジン-3-イル
469	プロピル	4-プロモ-2-クロロピリジン-5-イル
470	プロピル	4-メチルピリジン-2-イル
471	プロピル	5-メチルピリジン-2-イル
472	プロピル	4-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル
473	プロピル	6-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル

10

20

30

40

474	プロピル	5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-3-イル
475	プロピル	5-(ピロリジン-1-イル)-ピリジン-3-イル
476	プロピル	4-(ピロリジン-1-イル)-2-クロロピリジン-5-イル
477	プロピル	4-(モルホリン-4-イル)-2-クロロピリジン-5-イル
478	プロピル	2-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-5-イル
479	プロピル	5-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-2-イル
480	プロピル	2-フェノキシピリジン-5-イル
481	プロピル	2,3-ジクロロフェニル
482	プロピル	2,5-ジクロロフェニル
483	プロピル	3,5-ジクロロフェニル
484	プロピル	3-クロロ-4-フルオロフェニル
485	プロピル	4-ブロモ-2,5-ジクロロフェニル
486	プロピル	3-ブロモ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル
487	プロピル	3,5-ジブロモ-4-(2-フルオロエトキシ)フェニル
488	プロピル	2,5-ジメチルフェニル
489	プロピル	2,5-ジ-(トリフルオロメチル)フェニル
490	プロピル	3,5-ジ-(トリフルオロメチル)フェニル
491	プロピル	2,5-ジメトキシフェニル
492	プロピル	2-メトキシ-5-メチルフェニル
493	プロピル	2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
494	プロピル	4-フルオロ-3-(オキサゾール-4-イル)フェニル
495	プロピル	チエン-2-イル
496	プロピル	チエン-3-イル
497	プロピル	3-クロロチエン-2-イル
498	プロピル	4-クロロチエン-2-イル
499	プロピル	5-クロロチエン-2-イル
500	プロピル	3-ブロモチエン-2-イル
501	プロピル	4-ブロモチエン-2-イル
502	プロピル	5-ブロモチエン-2-イル
503	プロピル	4,5-ジクロロチエン-2-イル

10

20

30

40

504	プロピル	4, 5-ジプロモチエン-2-イル	
505	プロピル	4-プロモ-5-クロロチエン-2-イル	
506	プロピル	3-プロモ-5-クロロチエン-2-イル	
507	プロピル	5-メチルチエン-2-イル	
508	プロピル	5-エチルチエン-2-イル	
509	プロピル	5-プロピルチエン-2-イル	
510	プロピル	5-(トリフルオロメチル)-チエン-2-イル	10
511	プロピル	5-フェニルチエン-2-イル	
512	プロピル	5-(ピリド-2-イル)-チエン-2-イル	
513	プロピル	5-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル	
514	プロピル	4-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル	
515	プロピル	5-(ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル	
516	プロピル	5-(3-クロロ-5-トリフルオロ-ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル	20
517	プロピル	5-(ベンゾイルアミノメチル)-チエン-2-イル	
518	プロピル	5-(4-クロロベンゾイルアミノメチル)-チエン-2-イル	
519	プロピル	5-(アセチルアミノメチル)-チエン-2-イル	
520	プロピル	5-(ピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル	
521	プロピル	5-(ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル	
522	プロピル	5-(ピラゾール-4-イル)-チエン-2-イル	30
523	プロピル	5-(ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル	
524	プロピル	5-(4-フルオロピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル	
525	プロピル	5-(1-メチル-5-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル	
526	プロピル	5-(1-メチル-3-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル	
527	プロピル	5-(4-カルボキシ-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル	40

528	プロピル	5-(4-アミノメチル-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
529	プロピル	5-(イソオキサゾール-3-イル)-チエン-2-イル
530	プロピル	5-(イソオキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
531	プロピル	5-(イソオキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル
532	プロピル	5-(5-トリフルオロメチルイソオキサゾール-3-イル)-チエン-2-イル
533	プロピル	5-(オキサゾール-2-イル)-チエン-2-イル
534	プロピル	5-(オキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
535	プロピル	5-(オキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル
536	プロピル	5-(2-メチルオキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
537	プロピル	5-(2-メチルオキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル
538	プロピル	5-(イソチアゾール-3-イル)-チエン-2-イル
539	プロピル	5-(イソチアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
540	プロピル	5-(イソチアゾール-5-イル)-チエン-2-イル
541	プロピル	5-(5-トリフルオロメチルイソチアゾール-3-イル)-チエン-2-イル
542	プロピル	5-(チアゾール-2-イル)-チエン-2-イル
543	プロピル	5-(チアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
544	プロピル	5-(チアゾール-5-イル)-チエン-2-イル
545	プロピル	5-(2-メチルチアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
546	プロピル	5-(2-メチルチアゾール-5-イル)-チエン-2-イル
547	プロピル	5-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
548	プロピル	5-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
549	プロピル	5-(ピリミジン-2-イル)-チエン-2-イル
550	プロピル	5-(ピリミジン-4-イル)-チエン-2-イル
551	プロピル	5-(ピリミジン-5-イル)-チエン-2-イル

10

20

30

40

552	プロピル	5-(2-メチルチオピリミジン-4-イル)-チエン-2-イル	
553	プロピル	5-([1,3]-ジオキソラン-2-イル)-チエン-2-イル	
554	プロピル	5-([1,3]-ジオキソラン-2-イル)-チエン-2-イルチエン-2-イル	
555	プロピル	5-((3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル)-メチル)-チエン-2-イル	10
556	プロピル	5-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-ピリド-2-イルスルホニル]-チエン-2-イル	
557	プロピル	2-クロロチエン-3-イル	
558	プロピル	4-クロロチエン-3-イル	
559	プロピル	5-クロロチエン-3-イル	
560	プロピル	2-プロモチエン-3-イル	20
561	プロピル	4-プロモチエン-3-イル	
562	プロピル	5-プロモチエン-3-イル	
563	プロピル	2,5-ジクロロチエン-3-イル	
564	プロピル	2,5-ジプロモチエン-3-イル	
565	プロピル	2,4,5-トリクロロチエン-3-イル	
566	プロピル	4-プロモ-2,5-ジクロロチエン-3-イル	
567	プロピル	2-クロロ-5-メチルスルホニルチエン-3-イル	30
568	プロピル	2,5-ジメチルチエン-3-イル	
569	プロピル	4-ヒドロキシチエン-3-イル	
570	プロピル	2-フェニルチエン-3-イル	
571	プロピル	4-フェニル-5-(トリフルオロメチル)-チエン-3-イル	
572	プロピル	2-メトキシカルボニル-4-フェニル-5-(トリフルオロメチル)-チエン-3-イル	
573	プロピル	ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	40
574	プロピル	ベンゾ [b] チオフェン-3-イル	
575	プロピル	3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	

576	プロピル	5-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
577	プロピル	5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
578	プロピル	5-クロロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
579	プロピル	5-ブロモ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
580	エチル	3-メチルフェニル
581	エチル	3-エチルフェニル
582	エチル	3-プロピルフェニル
583	エチル	3-イソプロピルフェニル
584	エチル	3-sec-ブチルフェニル
585	エチル	3-tert-ブチルフェニル
586	エチル	3-イソブチルフェニル
587	エチル	3-(1,1-ジメチルプロピル)-フェニル
588	エチル	3-ビニルフェニル
589	エチル	3-イソプロペニルフェニル
590	エチル	3-フルオロフェニル
591	エチル	2-フルオロフェニル
592	エチル	3-クロロフェニル
593	エチル	3-ブロモフェニル
594	エチル	3-ヨードフェニル
595	エチル	3-(フルオロメチル)フェニル
596	エチル	3-(ジフルオロメチル)フェニル
597	エチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル
598	エチル	3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル
599	エチル	3-(1-フルオロエチル)-フェニル
600	エチル	3-(S)-1-フルオロエチル)-フェニル
601	エチル	3-(R)-1-フルオロエチル)-フェニル
602	エチル	3-(2-フルオロエチル)-フェニル
603	エチル	3-(1,1-ジフルオロエチル)-フェニル
604	エチル	3-(2,2-ジフルオロエチル)-フェニル
605	エチル	3-(2,2,2-トリフルオロエチル)-フェニル

10

20

30

40

606	エチル	3-(3-フルオロプロピル)-フェニル	
607	エチル	3-(2-フルオロプロピル)-フェニル	
608	エチル	3-((S)-2-フルオロプロピル)-フェニル	
609	エチル	3-((R)-2-フルオロプロピル)-フェニル	
610	エチル	3-(3,3-ジフルオロプロピル)-フェニル	
611	エチル	3-(3,3,3-トリフルオロプロピル)-フェニル	
612	エチル	3-(1-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	10
613	エチル	3-(2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
614	エチル	3-((S)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
615	エチル	3-((R)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
616	エチル	3-(2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
617	エチル	3-((S)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
618	エチル	3-((R)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	20
619	エチル	3-(2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
620	エチル	3-((S)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
621	エチル	3-((R)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	30
622	エチル	3-(2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル)-フェニル	
623	エチル	3-(1-ジフルオロメチル-2,2-ジフルオロエチル)-フェニル	
624	エチル	3-(1,1-ジメチル-2-フルオロエチル)-フェニル	
625	エチル	3-メトキシフェニル	
626	エチル	3-エトキシフェニル	
627	エチル	3-プロポキシフェニル	40
628	エチル	3-イソプロポキシフェニル	
629	エチル	3-ブトキシフェニル	

630	エチル	3- (フルオロメトキシ) -フェニル
631	エチル	3- (ジフルオロメトキシ) -フェニル
632	エチル	3- (トリフルオロメトキシ) -フェニル
633	エチル	3- (2-フルオロエトキシ) -フェニル
634	エチル	3- (2, 2-ジフルオロエトキシ) -フェニル
635	エチル	3- (2, 2, 2-トリフルオロエトキシ) -フェニル
636	エチル	3- (1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) -フェニル
637	エチル	3-シクロプロピルフェニル
638	エチル	3-シクロブチルフェニル
639	エチル	3-シクロペンチルフェニル
640	エチル	3- (2, 2-ジフルオロシクロプロピル) -フェニル
641	エチル	3, 4-ジフルオロフェニル
642	エチル	3-ブロモ-2-フルオロフェニル
643	エチル	2-ブロモ-3-フルオロフェニル
644	エチル	3-ブロモ-2, 5-ジフルオロフェニル
645	エチル	5-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
646	エチル	3-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
647	エチル	4-クロロ-3- (トリフルオロメチル) -フェニル
648	エチル	2-クロロ-5- (トリフルオロメチル) -フェニル
649	エチル	2-フルオロ-5- (トリフルオロメチル) -フェニル
650	エチル	4-フルオロ-3- (トリフルオロメチル) -フェニル
651	エチル	3-フルオロ-5- (トリフルオロメチル) -フェニル
652	エチル	4-ブロモ-3- (トリフルオロメチル) -フェニル
653	エチル	3-ブロモ-5- (トリフルオロメチル) -フェニル
654	エチル	2-ブロモ-5- (トリフルオロメチル) -フェニル
655	エチル	5-ブロモ-2-メトキシフェニル
656	エチル	3-ブロモ-4-メトキシフェニル
657	エチル	2-フルオロ-2-イソプロピルフェニル
658	エチル	4-フルオロ-3-イソプロピルフェニル
659	エチル	3- (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) -フェニル

10

20

30

40

660	エチル	3-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-フェニル
661	エチル	3-アセチルフェニル
662	エチル	3-アセチルアミノフェニル
663	エチル	3-カルボキシフェニル
664	エチル	3-シアノフェニル
665	エチル	3-ニトロフェニル
666	エチル	3-ヒドロキシフェニル
667	エチル	3-(O-ベンジル)-フェニル
668	エチル	3-(2-メトキシエトキシ)-フェニル
669	エチル	3-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-フェニル
670	エチル	3-(NH-CO-NH <sub>2</sub> )-フェニル
671	エチル	3-(メチルスルファニル)-フェニル
672	エチル	3-(フルオロメチルスルファニル)-フェニル
673	エチル	3-(ジフルオロメチルスルファニル)-フェニル
674	エチル	3-(トリフルオロメチルスルファニル)-フェニル
675	エチル	3-(メチルスルホニル)-フェニル
676	エチル	3-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ)-フェニル
677	エチル	3-(メトキシアミノ)-フェニル
678	エチル	3-(エトキシアミノ)-フェニル
679	エチル	3-(N-メチルアミノオキシ)-フェニル
680	エチル	3-(N, N-ジメチルアミノオキシ)-フェニル
681	エチル	3-(アゼチジン-1-イル)-フェニル
682	エチル	3-(2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
683	エチル	3-( (S) -2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
684	エチル	3-( (R) -2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
685	エチル	3-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)-フェニル
686	エチル	3-(2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-フェニル
687	エチル	3-(2-メトキシアゼチジン-1-イル)-フェニル
688	エチル	3-(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル)-フェニル
689	エチル	3-(ピロリジン-1-イル)-フェニル

10

20

30

40

690	エチル	3- (ピロリジン-2-イル) -フェニル	
691	エチル	3- ( (S) -ピロリジン-2-イル) -フェニル	
692	エチル	3- ( (R) -ピロリジン-2-イル) -フェニル	
693	エチル	3- (ピロリジン-3-イル) -フェニル	
694	エチル	3- ( (S) -ピロリジン-3-イル) -フェニル	
695	エチル	3- ( (R) -ピロリジン-3-イル) -フェニル	
696	エチル	3- (ピロリジン-1-イル) -5- (トリフルオロメチル) - フェニル	10
697	エチル	5- (ピロリジン-1-イル) -2-メトキシフェニル	
698	エチル	3- (ピロリジン-1-イル) -2-メトキシフェニル	
699	エチル	5- (ピロリジン-1-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル	
700	エチル	3- (ピロリジン-1-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル	
701	エチル	3- (2-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	20
702	エチル	3- ( (S) -2-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
703	エチル	3- ( (R) -2-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
704	エチル	3- (3-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
705	エチル	3- ( (S) -3-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
706	エチル	3- ( (R) -3-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	30
707	エチル	3- (2, 2-ジフルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
708	エチル	3- (3, 3-ジフルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
709	エチル	3- (2-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
710	エチル	3- ( (S) -2-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
711	エチル	3- ( (R) -2-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル	40
712	エチル	3- (3-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
713	エチル	3- ( (S) -3-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
714	エチル	3- ( (R) -3-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル	

715	エチル	3-(1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
716	エチル	3-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
717	エチル	3-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
718	エチル	3-(1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
719	エチル	3-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
720	エチル	3-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
721	エチル	3-(2,2-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	10
722	エチル	3-(3,3-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
723	エチル	3-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
724	エチル	3-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
725	エチル	3-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	20
726	エチル	3-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
727	エチル	3-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
728	エチル	3-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
729	エチル	3-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル	30
730	エチル	3-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル	
731	エチル	3-(ピペリジン-1-イル)-フェニル	
732	エチル	3-(2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
733	エチル	3-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
734	エチル	3-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
735	エチル	3-(2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
736	エチル	3-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	40
737	エチル	3-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
738	エチル	3-(2,2-ジフルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	

739	エチル	3- (ピペラジン-1-イル) -フェニル
740	エチル	3- (4-メチルピペラジン-1-イル) -フェニル
741	エチル	3- (モルホリン-4-イル) -フェニル
742	エチル	3- (モルホリン-4-イル) -5- (トリフルオロメチル) -フェニル
743	エチル	5- (モルホリン-4-イル) -2-メトキシフェニル
744	エチル	3- (モルホリン-4-イル) -4-メトキシフェニル
745	エチル	5- (モルホリン-4-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル
746	エチル	3- (モルホリン-4-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル
747	エチル	3- (チオモルホリン-4-イル) -フェニル
748	エチル	3- (1-オキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル
749	エチル	3- (1, 1-ジオキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル
750	エチル	3- (ピロール-1-イル) -フェニル
751	エチル	3- (ピロール-2-イル) -フェニル
752	エチル	3- (ピロール-3-イル) -フェニル
753	エチル	3- (1-メチルピロール-2-イル) -フェニル
754	エチル	3- (1-メチルピロール-3-イル) -フェニル
755	エチル	3- (フラン-2-イル) -フェニル
756	エチル	3- (フラン-3-イル) -フェニル
757	エチル	3- (チオフエン-2-イル) -フェニル
758	エチル	3- (チオフエン-3-イル) -フェニル
759	エチル	3- (5-プロピルチエン-2-イル) -フェニル
760	エチル	3- (ピラゾール-1-イル) -フェニル
761	エチル	3- (ピラゾール-3-イル) -フェニル
762	エチル	3- (ピラゾール-4-イル) -フェニル
763	エチル	3- (4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル
764	エチル	3- (1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
765	エチル	3- (1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
766	エチル	3- (1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) -フェニル
767	エチル	3- (1H-イミダゾール-2-イル) -フェニル

10

20

30

40

768	エチル	3- (イミダゾール-1-イル) -フェニル	
769	エチル	3- (1-メチルイミダゾール-2-イル) -フェニル	
770	エチル	3- (オキサゾール-2-イル) -フェニル	
771	エチル	3- (オキサゾール-4-イル) -フェニル	
772	エチル	3- (オキサゾール-5-イル) -フェニル	
773	エチル	3- (イソオキサゾール-3-イル) -フェニル	
774	エチル	3- (イソオキサゾール-4-イル) -フェニル	10
775	エチル	3- (イソオキサゾール-5-イル) -フェニル	
776	エチル	3- (チアゾール-2-イル) -フェニル	
777	エチル	3- (チアゾール-4-イル) -フェニル	
778	エチル	3- (チアゾール-5-イル) -フェニル	
779	エチル	3- (2-メチルチアゾール-4-イル) -フェニル	
780	エチル	3- (2-メチルチアゾール-5-イル) -フェニル	
781	エチル	3- ([1, 2, 3] -トリアゾール-1-イル) -フェニル	20
782	エチル	3- ([1, 2, 4] -トリアゾール-1-イル) -フェニル	
783	エチル	3- ([1, 2, 3] -トリアゾール-2-イル) -フェニル	
784	エチル	3- (4H-[1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル	
785	エチル	3- ([1, 2, 4] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
786	エチル	3- (2H-[1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	30
787	エチル	3- (4-メチル-4H-[1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル	
788	エチル	3- (2-メチル-2H-[1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
789	エチル	3- ([1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル	
790	エチル	3- (5-メチル-[1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル	40

791	エチル	3-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
792	エチル	3-(5-メチル-[1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
793	エチル	3-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	
794	エチル	3-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-フェニル	10
795	エチル	3-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	
796	エチル	3-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-フェニル	
797	エチル	3-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
798	エチル	3-(テトラゾール-1-イル)-フェニル	20
799	エチル	3-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
800	エチル	3-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
801	エチル	3-フラザン-3-イル-フェニル	
802	エチル	3-(ピリド-2-イル)-フェニル	
803	エチル	3-(ピリド-3-イル)-フェニル	30
804	エチル	3-(ピリド-4-イル)-フェニル	
805	エチル	3-(ピリミジン-2-イル)-フェニル	
806	エチル	3-(2-メチルピリミジン-4-イル)-フェニル	
807	エチル	3-(ピリミジン-4-イル)-フェニル	
808	エチル	3-(ピリミジン-5-イル)-フェニル	
809	エチル	5-プロモピリジン-3-イル	
810	エチル	3-プロモ-2-クロロピリジン-5-イル	40
811	エチル	4-メチルピリジン-2-イル	

812	エチル	6-メチルピリジン-2-イル
813	エチル	4-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル
814	エチル	6-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル
815	エチル	5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-3-イル
816	エチル	5-(ピロリジン-1-イル)-ピリジン-3-イル
817	エチル	3-(ピロリジン-1-イル)-2-クロロピリジン-5-イル
818	エチル	3-(モルホリン-4-イル)-2-クロロピリジン-5-イル
819	エチル	2-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-5-イル
820	エチル	2-フェノキシピリジン-5-イル
821	エチル	4-メチルフェニル
822	エチル	4-エチルフェニル
823	エチル	4-プロピルフェニル
824	エチル	4-イソプロピルフェニル
825	エチル	4-sec-ブチルフェニル
826	エチル	4-tert-ブチルフェニル
827	エチル	4-イソブチルフェニル
828	エチル	4-(1,1-ジメチルプロピル)-フェニル
829	エチル	4-ビニルフェニル
830	エチル	4-イソプロペニルフェニル
831	エチル	4-フルオロフェニル
832	エチル	4-クロロフェニル
833	エチル	4-ブロモフェニル
834	エチル	4-ヨードフェニル
835	エチル	4-(フルオロメチル)フェニル
836	エチル	4-(ジフルオロメチル)フェニル
837	エチル	4-(トリフルオロメチル)フェニル
838	エチル	2,4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル
839	エチル	4-(1-フルオロエチル)-フェニル
840	エチル	4-((S)-1-フルオロエチル)-フェニル
841	エチル	4-((R)-1-フルオロエチル)-フェニル

10

20

30

40

842	エチル	4-(2-フルオロエチル)-フェニル	
843	エチル	4-(1,1-ジフルオロエチル)-フェニル	
844	エチル	4-(2,2-ジフルオロエチル)-フェニル	
845	エチル	4-(2,2,2-トリフルオロエチル)-フェニル	
846	エチル	4-(3-フルオロプロピル)-フェニル	
847	エチル	4-(2-フルオロプロピル)-フェニル	
848	エチル	4-((S)-2-フルオロプロピル)-フェニル	10
849	エチル	4-((R)-2-フルオロプロピル)-フェニル	
850	エチル	4-(3,3-ジフルオロプロピル)-フェニル	
851	エチル	4-(3,3,3-トリフルオロプロピル)-フェニル	
852	エチル	4-(1-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
853	エチル	4-(2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
854	エチル	4-((S)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	20
855	エチル	4-((R)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
856	エチル	4-(2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
857	エチル	4-((S)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
858	エチル	4-((R)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
859	エチル	4-(2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	30
860	エチル	4-((S)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
861	エチル	4-((R)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
862	エチル	4-(2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル)-フェニル	
863	エチル	4-(1-ジフルオロメチル-2,2-ジフルオロエチル)-フェニル	40
864	エチル	4-(1,1-ジメチル-2-フルオロエチル)-フェニル	
865	エチル	4-メトキシフェニル	

866	エチル	4-エトキシフェニル
867	エチル	4-プロポキシフェニル
868	エチル	4-イソプロポキシフェニル
869	エチル	4-ブトキシフェニル
870	エチル	4-(フルオロメトキシ)フェニル
871	エチル	4-(ジフルオロメトキシ)フェニル
872	エチル	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル
873	エチル	4-(2-フルオロエトキシ)フェニル
874	エチル	4-(2, 2-ジフルオロエトキシ)フェニル
875	エチル	4-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)フェニル
876	エチル	4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェニル
877	エチル	4-シクロプロピルフェニル
878	エチル	4-シクロブチルフェニル
879	エチル	4-シクロペンチルフェニル
880	エチル	4-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル)フェニル
881	エチル	3, 4-ジフルオロフェニル
882	エチル	4-ブロモ-2-フルオロフェニル
883	エチル	2-ブロモ-4-フルオロフェニル
884	エチル	4-ブロモ-2, 5-ジフルオロフェニル
885	エチル	5-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
886	エチル	3-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
887	エチル	3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル
888	エチル	4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル
889	エチル	3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
890	エチル	3-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)フェニル
891	エチル	5-ブロモ-3-(トリフルオロメチル)フェニル
892	エチル	5-ブロモ-2-(トリフルオロメチル)フェニル
893	エチル	2-ブロモ-5-メトキシフェニル
894	エチル	4-ブロモ-3-メトキシフェニル
895	エチル	3-フルオロ-2-イソプロピルフェニル

10

20

30

40

896	エチル	3-フルオロ-4-イソプロピルフェニル
897	エチル	4-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)-フェニル
898	エチル	4-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-フェニル
899	エチル	4-アセチルフェニル
900	エチル	4-アセチルアミノフェニル
901	エチル	4-カルボキシフェニル
902	エチル	4-シアノフェニル
903	エチル	4-ニトロフェニル
904	エチル	4-ヒドロキシフェニル
905	エチル	4-(O-ベンジル)-フェニル
906	エチル	4-(2-メトキシエトキシ)-フェニル
907	エチル	4-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-フェニル
908	エチル	4-(NH-CO-NH <sub>2</sub> )-フェニル
909	エチル	4-(メチルスルファニル)-フェニル
910	エチル	4-(フルオロメチルスルファニル)-フェニル
911	エチル	4-(ジフルオロメチルスルファニル)-フェニル
912	エチル	4-(トリフルオロメチルスルファニル)-フェニル
913	エチル	4-(メチルスルホニル)-フェニル
914	エチル	4-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ)-フェニル
915	エチル	4-(メトキシアミノ)-フェニル
916	エチル	4-(エトキシアミノ)-フェニル
917	エチル	4-(N-メチルアミノオキシ)-フェニル
918	エチル	4-(N, N-ジメチルアミノオキシ)-フェニル
919	エチル	4-(アゼチジン-1-イル)-フェニル
920	エチル	4-(2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
921	エチル	4-((S)-2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
922	エチル	4-((R)-2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
923	エチル	4-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)-フェニル
924	エチル	4-(2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-フェニル
925	エチル	4-(2-メトキシアゼチジン-1-イル)-フェニル

10

20

30

40

926	エチル	4-(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル) -フェニル
927	エチル	4-(ピロリジン-1-イル) -フェニル
928	エチル	4-(ピロリジン-2-イル) -フェニル
929	エチル	4-( (S) -ピロリジン-2-イル) -フェニル
930	エチル	3-( (R) -ピロリジン-2-イル) -フェニル
931	エチル	4-(ピロリジン-3-イル) -フェニル
932	エチル	4-( (S) -ピロリジン-3-イル) -フェニル
933	エチル	4-( (R) -ピロリジン-3-イル) -フェニル
934	エチル	4-(ピロリジン-1-イル) -5-(トリフルオロメチル) - フェニル
935	エチル	4-(ピロリジン-1-イル) -2-メトキシフェニル
936	エチル	4-(ピロリジン-1-イル) -3,4-メトキシフェニル
937	エチル	4-(ピロリジン-1-イル) -2, 5-ジフルオロフェニル
938	エチル	4-(ピロリジン-1-イル) -2, 6-ジフルオロフェニル
939	エチル	4-(2-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル
940	エチル	4-( (S) -2-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル
941	エチル	4-( (R) -2-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル
942	エチル	4-(3-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル
943	エチル	4-( (S) -3-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル
944	エチル	4-( (R) -3-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル
945	エチル	4-(2, 2-ジフルオロピロリジン-1-イル) -フェニル
946	エチル	4-(3, 3-ジフルオロピロリジン-1-イル) -フェニル
947	エチル	4-(2-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル
948	エチル	4-( (S) -2-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル
949	エチル	4-( (R) -2-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル
950	エチル	4-(3-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル

10

20

30

40

951	エチル	4-((S)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
952	エチル	4-((R)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
953	エチル	4-(1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
954	エチル	4-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
955	エチル	4-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
956	エチル	4-(1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
957	エチル	4-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	10
958	エチル	4-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
959	エチル	4-(2,2-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
960	エチル	4-(3,3-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
961	エチル	4-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
962	エチル	4-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	20
963	エチル	4-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
964	エチル	4-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
965	エチル	4-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
966	エチル	4-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	30
967	エチル	4-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル	
968	エチル	4-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル	
969	エチル	4-(ピペリジン-1-イル)-フェニル	
970	エチル	4-(2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
971	エチル	4-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
972	エチル	4-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	40
973	エチル	4-(2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
974	エチル	4-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	

975	エチル	4-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル
976	エチル	4-(2,2-ジフルオロピペリジン-1-イル)-フェニル
977	エチル	4-(ピペラジン-1-イル)-フェニル
978	エチル	4-(4-メチルピペラジン-1-イル)-フェニル
979	エチル	4-(モルホリン-4-イル)-フェニル
980	エチル	4-(モルホリン-4-イル)-5-(トリフルオロメチル)-フェニル
981	エチル	4-(モルホリン-4-イル)-2-メトキシフェニル
982	エチル	4-(モルホリン-4-イル)-3-メトキシフェニル
983	エチル	4-(モルホリン-4-イル)-2,5-ジフルオロフェニル
984	エチル	4-(モルホリン-4-イル)-2,6-ジフルオロフェニル
985	エチル	4-(チオモルホリン-4-イル)-フェニル
986	エチル	4-(1-オキソチオモルホリン-4-イル)-フェニル
987	エチル	4-(1,1-ジオキソチオモルホリン-4-イル)-フェニル
988	エチル	4-(ピロール-1-イル)-フェニル
989	エチル	4-(ピロール-2-イル)-フェニル
990	エチル	4-(ピロール-3-イル)-フェニル
991	エチル	4-(1-メチルピロール-2-イル)-フェニル
992	エチル	4-(1-メチルピロール-3-イル)-フェニル
993	エチル	4-(フラン-2-イル)-フェニル
994	エチル	4-(フラン-3-イル)-フェニル
995	エチル	4-(チオフエン-2-イル)-フェニル
996	エチル	4-(チオフエン-3-イル)-フェニル
997	エチル	4-(5-プロピルチエン-2-イル)-フェニル
998	エチル	4-(ピラゾール-1-イル)-フェニル
999	エチル	4-(ピラゾール-3-イル)-フェニル
1000	エチル	4-(ピラゾール-4-イル)-フェニル
1001	エチル	4-(4-フルオロピラゾール-1-イル)-フェニル
1002	エチル	4-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル
1003	エチル	4-(1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル

10

20

30

40

1004	エチル	4- (1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) -フェニル	
1005	エチル	4- (1H-イミダゾール-2-イル) -フェニル	
1006	エチル	4- (イミダゾール-1-イル) -フェニル	
1007	エチル	4- (1-メチルイミダゾール-2-イル) -フェニル	
1008	エチル	4- (オキサゾール-2-イル) -フェニル	
1009	エチル	4- (オキサゾール-4-イル) -フェニル	
1010	エチル	4- (オキサゾール-5-イル) -フェニル	10
1011	エチル	4- (イソオキサゾール-3-イル) -フェニル	
1012	エチル	4- (イソオキサゾール-4-イル) -フェニル	
1013	エチル	3- (イソオキサゾール-5-イル) -フェニル	
1014	エチル	4- (チアゾール-2-イル) -フェニル	
1015	エチル	4- (チアゾール-4-イル) -フェニル	
1016	エチル	4- (チアゾール-5-イル) -フェニル	
1017	エチル	4- (2-メチルチアゾール-4-イル) -フェニル	20
1018	エチル	4- (2-メチルチアゾール-5-イル) -フェニル	
1019	エチル	4- ([1, 2, 3]-トリアゾール-1-イル) -フェニル	
1020	エチル	4- ([1, 2, 4]-トリアゾール-1-イル) -フェニル	
1021	エチル	4- ([1, 2, 3]-トリアゾール-2-イル) -フェニル	
1022	エチル	4- (4H-[1, 2, 4]-トリアゾール-3-イル) -フェニル	
1023	エチル	4- ([1, 2, 4]-トリアゾール-4-イル) -フェニル	30
1024	エチル	4- (2H-[1, 2, 3]-トリアゾール-4-イル) -フェニル	
1025	エチル	4- (4-メチル-4H-[1, 2, 4]-トリアゾール-3-イル) -フェニル	
1026	エチル	4- (2-メチル-2H-[1, 2, 3]-トリアゾール-4-イル) -フェニル	
1027	エチル	4- ([1, 3, 4]-オキサジアゾール-2-イル) -フェニル	40

1028	エチル	4-(5-メチル-[1, 3, 4]-オキサジアゾール-2-イル)-フェニル	
1029	エチル	4-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
1030	エチル	4-(5-メチル-[1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
1031	エチル	4-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	10
1032	エチル	4-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-フェニル	
1033	エチル	4-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	
1034	エチル	4-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-フェニル	20
1035	エチル	4-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
1036	エチル	4-(テトラゾール-1-イル)-フェニル	
1037	エチル	4-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
1038	エチル	4-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
1039	エチル	4-フラザン-3-イル-フェニル	30
1040	エチル	4-(ピリド-2-イル)-フェニル	
1041	エチル	4-(ピリド-3-イル)-フェニル	
1042	エチル	4-(ピリド-4-イル)-フェニル	
1043	エチル	4-(ピリミジン-2-イル)-フェニル	
1044	エチル	4-(2-メチルピリミジン-4-イル)-フェニル	
1045	エチル	4-(ピリミジン-4-イル)-フェニル	
1046	エチル	4-(ピリミジン-5-イル)-フェニル	40
1047	エチル	5-プロモピリジン-3-イル	

1048	エチル	4-ブロモ-2-クロロピリジン-5-イル	
1049	エチル	4-メチルピリジン-2-イル	
1050	エチル	5-メチルピリジン-2-イル	
1051	エチル	4-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル	
1052	エチル	6-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル	
1053	エチル	5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-3-イル	
1054	エチル	5-(ピロリジン-1-イル)-ピリジン-3-イル	10
1055	エチル	4-(ピロリジン-1-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	
1056	エチル	4-(モルホリン-4-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	
1057	エチル	2-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-5-イル	
1058	エチル	5-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-2-イル	
1059	エチル	2-フェノキシピリジン-5-イル	
1060	エチル	2,3-ジクロロフェニル	
1061	エチル	2,5-ジクロロフェニル	20
1062	エチル	3,5-ジクロロフェニル	
1063	エチル	3-クロロ-4-フルオロフェニル	
1064	エチル	4-ブロモ-2,5-ジクロロフェニル	
1065	エチル	3-ブロモ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル	
1066	エチル	3,5-ジブロモ-4-(2-フルオロエトキシ)フェニル	
1067	エチル	2,5-ジメチルフェニル	
1068	エチル	2,5-ジ-(トリフルオロメチル)フェニル	30
1069	エチル	3,5-ジ-(トリフルオロメチル)フェニル	
1070	エチル	2,5-ジメトキシフェニル	
1071	エチル	2-メトキシ-5-メチルフェニル	
1072	エチル	2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル	
1073	エチル	4-フルオロ-3-(オキサゾール-4-イル)フェニル	
1074	エチル	チエン-2-イル	
1075	エチル	チエン-3-イル	40
1076	エチル	3-クロロチエン-2-イル	
1077	エチル	4-クロロチエン-2-イル	

1078	エチル	5-クロロチエン-2-イル	
1079	エチル	3-プロモチエン-2-イル	
1080	エチル	4-プロモチエン-2-イル	
1081	エチル	5-プロモチエン-2-イル	
1082	エチル	4, 5-ジクロロチエン-2-イル	
1083	エチル	4, 5-ジプロモチエン-2-イル	
1084	エチル	4-プロモ-5-クロロチエン-2-イル	10
1085	エチル	3-プロモ-5-クロロチエン-2-イル	
1086	エチル	5-メチルチエン-2-イル	
1087	エチル	5-エチルチエン-2-イル	
1088	エチル	5-プロピルチエン-2-イル	
1089	エチル	5-(トリフルオロメチル)-チエン-2-イル	
1090	エチル	5-フェニルチエン-2-イル	
1091	エチル	5-(ピリド-2-イル)-チエン-2-イル	20
1092	エチル	5-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル	
1093	エチル	4-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル	
1094	エチル	5-(ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル	
1095	エチル	5-(3-クロロ-5-トリフルオロ-ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル	
1096	エチル	5-(ベンゾイルアミノメチル)-チエン-2-イル	
1097	エチル	5-(4-クロロベンゾイルアミノメチル)-チエン-2-イル	30
1098	エチル	5-(アセチルアミノメチル)-チエン-2-イル	
1099	エチル	5-(ピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル	
1100	エチル	5-(ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル	
1101	エチル	5-(ピラゾール-4-イル)-チエン-2-イル	
1102	エチル	5-(ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル	
1103	エチル	5-(4-フルオロピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル	40
1104	エチル	5-(1-メチル-5-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル	

1105	エチル	5-(1-メチル-3-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル
1106	エチル	5-(4-カルボキシ-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
1107	エチル	5-(4-アミノメチル-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
1108	エチル	5-(イソオキサゾール-3-イル)-チエン-2-イル
1109	エチル	5-(イソオキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
1110	エチル	5-(イソオキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル
1111	エチル	5-(5-トリフルオロメチルイソオキサゾール-3-イル)-チエン-2-イル
1112	エチル	5-(オキサゾール-2-イル)-チエン-2-イル
1113	エチル	5-(オキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
1114	エチル	5-(オキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル
1115	エチル	5-(2-メチルオキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
1116	エチル	5-(2-メチルオキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル
1117	エチル	5-(イソチアゾール-3-イル)-チエン-2-イル
1118	エチル	5-(イソチアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
1119	エチル	5-(イソチアゾール-5-イル)-チエン-2-イル
1120	エチル	5-(5-トリフルオロメチルイソチアゾール-3-イル)-チエン-2-イル
1121	エチル	5-(チアゾール-2-イル)-チエン-2-イル
1122	エチル	5-(チアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
1123	エチル	5-(チアゾール-5-イル)-チエン-2-イル
1124	エチル	5-(2-メチルチアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
1125	エチル	5-(2-メチルチアゾール-5-イル)-チエン-2-イル
1126	エチル	5-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
1127	エチル	5-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-チエン-2-イル

10

20

30

40

1128	エチル	5-(ピリミジン-2-イル)-チエン-2-イル	
1129	エチル	5-(ピリミジン-4-イル)-チエン-2-イル	
1130	エチル	5-(ピリミジン-5-イル)-チエン-2-イル	
1131	エチル	5-(2-メチルチオピリミジン-4-イル)-チエン-2-イル	
1132	エチル	5-([1, 3]-ジオキソラン-2-イル)-チエン-2-イル	10
1133	エチル	5-([1, 3]-ジオキソラン-2-イル)-チエン-2-イル チエン-2-イル	
1134	エチル	5-(3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル)-メチル)-チエン-2-イル	
1135	エチル	5-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-ピリド-2-イルスルホニル]-チエン-2-イル	
1136	エチル	2-クロロチエン-3-イル	20
1137	エチル	4-クロロチエン-3-イル	
1138	エチル	5-クロロチエン-3-イル	
1139	エチル	2-ブロモチエン-3-イル	
1140	エチル	4-ブロモチエン-3-イル	
1141	エチル	5-ブロモチエン-3-イル	
1142	エチル	2, 5-ジクロロチエン-3-イル	
1143	エチル	2, 5-ジブロモチエン-3-イル	30
1144	エチル	2, 4, 5-トリクロロチエン-3-イル	
1145	エチル	4-ブロモ-2, 5-ジクロロチエン-3-イル	
1146	エチル	2-クロロ-5-メチルスルホニルチエン-3-イル	
1147	エチル	2, 5-ジメチルチエン-3-イル	
1148	エチル	4-ヒドロキシチエン-3-イル	
1149	エチル	2-フェニルチエン-3-イル	
1150	エチル	4-フェニル-5-(トリフルオロメチル)-チエン-3-イル	40
1151	エチル	2-メトキシカルボニル-4-フェニル-5-(トリフルオロメチル)-チエン-3-イル	

1152	エチル	ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
1153	エチル	ベンゾ [b] チオフェン-3-イル
1154	エチル	3-メチルベンゾ [b] チオフェン-2-イル
1155	エチル	5-メチルベンゾ [b] チオフェン-2-イル
1156	エチル	5-フルオロ-3-メチルベンゾ [b] チオフェン-2-イル
1157	エチル	5-クロロ-3-メチルベンゾ [b] チオフェン-2-イル
1158	エチル	5-ブロモ-3-メチルベンゾ [b] チオフェン-2-イル
1159	メチル	3-メチルフェニル
1160	メチル	3-エチルフェニル
1161	メチル	3-プロピルフェニル
1162	メチル	3-イソプロピルフェニル
1163	メチル	3-sec-ブチルフェニル
1164	メチル	3-tert-ブチルフェニル
1165	メチル	3-イソブチルフェニル
1166	メチル	3-(1,1-ジメチルプロピル)フェニル
1167	メチル	3-ビニルフェニル
1168	メチル	3-イソプロペニルフェニル
1169	メチル	3-フルオロフェニル
1170	メチル	2-フルオロフェニル
1171	メチル	3-クロロフェニル
1172	メチル	3-ブロモフェニル
1173	メチル	3-ヨードフェニル
1174	メチル	3-(フルオロメチル)フェニル
1175	メチル	3-(ジフルオロメチル)フェニル
1176	メチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル
1177	メチル	3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル
1178	メチル	3-(1-フルオロエチル)フェニル
1179	メチル	3-( (S) -1-フルオロエチル)フェニル
1180	メチル	3-( (R) -1-フルオロエチル)フェニル
1181	メチル	3-(2-フルオロエチル)フェニル

10

20

30

40

1182	メチル	3- (1, 1-ジフルオロエチル) -フェニル	
1183	メチル	3- (2, 2-ジフルオロエチル) -フェニル	
1184	メチル	3- (2, 2, 2-トリフルオロエチル) -フェニル	
1185	メチル	3- (3-フルオロプロピル) -フェニル	
1186	メチル	3- (2-フルオロプロピル) -フェニル	
1187	メチル	3- ( (S) -2-フルオロプロピル) -フェニル	
1188	メチル	3- ( (R) -2-フルオロプロピル) -フェニル	10
1189	メチル	3- (3, 3-ジフルオロプロピル) -フェニル	
1190	メチル	3- (3, 3, 3-トリフルオロプロピル) -フェニル	
1191	メチル	3- (1-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1192	メチル	3- (2-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1193	メチル	3- ( (S) -2-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1194	メチル	3- ( (R) -2-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	20
1195	メチル	3- (2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1196	メチル	3- ( (S) -2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1197	メチル	3- ( (R) -2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1198	メチル	3- (2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1199	メチル	3- ( (S) -2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	30
1200	メチル	3- ( (R) -2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1201	メチル	3- (2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル) -フェニル	
1202	メチル	3- (1-ジフルオロメチル-2, 2-ジフルオロエチル) -フェニル	
1203	メチル	3- (1, 1-ジメチル-2-フルオロエチル) -フェニル	40
1204	メチル	3-メトキシフェニル	
1205	メチル	3-エトキシフェニル	

1206	メチル	3-プロポキシフェニル	
1207	メチル	3-イソプロポキシフェニル	
1208	メチル	3-ブトキシフェニル	
1209	メチル	3-(フルオロメトキシ)フェニル	
1210	メチル	3-(ジフルオロメトキシ)フェニル	
1211	メチル	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル	
1212	メチル	3-(2-フルオロエトキシ)フェニル	10
1213	メチル	3-(2, 2-ジフルオロエトキシ)フェニル	
1214	メチル	3-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)フェニル	
1215	メチル	3-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェニル	
1216	メチル	3-シクロプロピルフェニル	
1217	メチル	3-シクロブチルフェニル	
1218	メチル	3-シクロペンチルフェニル	
1219	メチル	3-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル)フェニル	20
1220	メチル	3, 4-ジフルオロフェニル	
1221	メチル	3-ブロモ-2-フルオロフェニル	
1222	メチル	2-ブロモ-3-フルオロフェニル	
1223	メチル	3-ブロモ-2, 5-ジフルオロフェニル	
1224	メチル	5-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル	
1225	メチル	3-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル	
1226	メチル	4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル	30
1227	メチル	2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル	
1228	メチル	2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル	
1229	メチル	4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル	
1230	メチル	3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル	
1231	メチル	4-ブロモ-3-(トリフルオロメチル)フェニル	
1232	メチル	3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニル	
1233	メチル	2-ブロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニル	40
1234	メチル	5-ブロモ-2-メトキシフェニル	
1235	メチル	3-ブロモ-4-メトキシフェニル	

1236	メチル	2-フルオロ-2-イソプロピルフェニル
1237	メチル	4-フルオロ-3-イソプロピルフェニル
1238	メチル	3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)-フェニル
1239	メチル	3-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-フェニル
1240	メチル	3-アセチルフェニル
1241	メチル	3-アセチルアミノフェニル
1242	メチル	3-カルボキシフェニル
1243	メチル	3-シアノフェニル
1244	メチル	3-ニトロフェニル
1245	メチル	3-ヒドロキシフェニル
1246	メチル	3-(O-ベンジル)-フェニル
1247	メチル	3-(2-メトキシエトキシ)-フェニル
1248	メチル	3-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-フェニル
1249	メチル	3-(NH-CO-NH <sub>2</sub> )-フェニル
1250	メチル	3-(メチルスルファニル)-フェニル
1251	メチル	3-(フルオロメチルスルファニル)-フェニル
1252	メチル	3-(ジフルオロメチルスルファニル)-フェニル
1253	メチル	3-(トリフルオロメチルスルファニル)-フェニル
1254	メチル	3-(メチルスルホニル)-フェニル
1255	メチル	3-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ)-フェニル
1256	メチル	3-(メトキシアミノ)-フェニル
1257	メチル	3-(エトキシアミノ)-フェニル
1258	メチル	3-(N-メチルアミノオキシ)-フェニル
1259	メチル	3-(N, N-ジメチルアミノオキシ)-フェニル
1260	メチル	3-(アゼチジン-1-イル)-フェニル
1261	メチル	3-(2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
1262	メチル	3-( (S) -2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
1263	メチル	3-( (R) -2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
1264	メチル	3-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)-フェニル
1265	メチル	3-(2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-フェニル

10

20

30

40

1266	メチル	3-(2-メトキシアゼチジン-1-イル)-フェニル
1267	メチル	3-(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル)-フェニル
1268	メチル	3-(ピロリジン-1-イル)-フェニル
1269	メチル	3-(ピロリジン-2-イル)-フェニル
1270	メチル	3-(S)-ピロリジン-2-イル)-フェニル
1271	メチル	3-(R)-ピロリジン-2-イル)-フェニル
1272	メチル	3-(ピロリジン-3-イル)-フェニル
1273	メチル	3-(S)-ピロリジン-3-イル)-フェニル
1274	メチル	3-(R)-ピロリジン-3-イル)-フェニル
1275	メチル	3-(ピロリジン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)- フェニル
1276	メチル	5-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル
1277	メチル	3-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル
1278	メチル	5-(ピロリジン-1-イル)-2,4-ジフルオロフェニル
1279	メチル	3-(ピロリジン-1-イル)-2,4-ジフルオロフェニル
1280	メチル	3-(2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1281	メチル	3-(S)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1282	メチル	3-(R)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1283	メチル	3-(3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1284	メチル	3-(S)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1285	メチル	3-(R)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1286	メチル	3-(2,2-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1287	メチル	3-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1288	メチル	3-(2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1289	メチル	3-(S)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1290	メチル	3-(R)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル

10

20

30

40

1291	メチル	3-(3-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル
1292	メチル	3-((S)-3-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル
1293	メチル	3-((R)-3-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル
1294	メチル	3-(1-メチルピロリジン-2-イル) -フェニル
1295	メチル	3-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル) -フェニル
1296	メチル	3-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル) -フェニル
1297	メチル	3-(1-メチルピロリジン-3-イル) -フェニル
1298	メチル	3-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル) -フェニル
1299	メチル	3-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル) -フェニル
1300	メチル	3-(2,2-ジメチルピロリジン-1-イル) -フェニル
1301	メチル	3-(3,3-ジメチルピロリジン-1-イル) -フェニル
1302	メチル	3-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル) -フェニル
1303	メチル	3-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル) -フェニル
1304	メチル	3-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル) -フェニル
1305	メチル	3-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル) -フェニル
1306	メチル	3-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル) -フェニル
1307	メチル	3-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル) -フェニル
1308	メチル	3-(2-オキソピロリジン-1-イル) -フェニル
1309	メチル	3-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル) -フェニル
1310	メチル	3-(ピペリジン-1-イル) -フェニル
1311	メチル	3-(2-メチルピペリジン-1-イル) -フェニル
1312	メチル	3-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル) -フェニル
1313	メチル	3-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル) -フェニル
1314	メチル	3-(2-フルオロピペリジン-1-イル) -フェニル

10

20

30

40

1315	メチル	3-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
1316	メチル	3-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
1317	メチル	3-(2,2-ジフルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
1318	メチル	3-(ピペラジン-1-イル)-フェニル	
1319	メチル	3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-フェニル	
1320	メチル	3-(モルホリン-4-イル)-フェニル	
1321	メチル	3-(モルホリン-4-イル)-5-(トリフルオロメチル)-フェニル	10
1322	メチル	5-(モルホリン-4-イル)-2-メトキシフェニル	
1323	メチル	3-(モルホリン-4-イル)-4-メトキシフェニル	
1324	メチル	5-(モルホリン-4-イル)-2,4-ジフルオロフェニル	
1325	メチル	3-(モルホリン-4-イル)-2,4-ジフルオロフェニル	
1326	メチル	3-(チオモルホリン-4-イル)-フェニル	
1327	メチル	3-(1-オキソチオモルホリン-4-イル)-フェニル	20
1328	メチル	3-(1,1-ジオキソチオモルホリン-4-イル)-フェニル	
1329	メチル	3-(ピロール-1-イル)-フェニル	
1330	メチル	3-(ピロール-2-イル)-フェニル	
1331	メチル	3-(ピロール-3-イル)-フェニル	
1332	メチル	3-(1-メチルピロール-2-イル)-フェニル	
1333	メチル	3-(1-メチルピロール-3-イル)-フェニル	
1334	メチル	3-(フラン-2-イル)-フェニル	30
1335	メチル	3-(フラン-3-イル)-フェニル	
1336	メチル	3-(チオフエン-2-イル)-フェニル	
1337	メチル	3-(チオフエン-3-イル)-フェニル	
1338	メチル	3-(5-プロピルチエン-2-イル)-フェニル	
1339	メチル	3-(ピラゾール-1-イル)-フェニル	
1340	メチル	3-(ピラゾール-3-イル)-フェニル	
1341	メチル	3-(ピラゾール-4-イル)-フェニル	40
1342	メチル	3-(4-フルオロピラゾール-1-イル)-フェニル	
1343	メチル	3-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル	

1344	メチル	3- (1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル	
1345	メチル	3- (1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) -フェニル	
1346	メチル	3- (1H-イミダゾール-2-イル) -フェニル	
1347	メチル	3- (イミダゾール-1-イル) -フェニル	
1348	メチル	3- (1-メチルイミダゾール-2-イル) -フェニル	
1349	メチル	3- (オキサゾール-2-イル) -フェニル	
1350	メチル	3- (オキサゾール-4-イル) -フェニル	10
1351	メチル	3- (オキサゾール-5-イル) -フェニル	
1352	メチル	3- (イソオキサゾール-3-イル) -フェニル	
1353	メチル	3- (イソオキサゾール-4-イル) -フェニル	
1354	メチル	3- (イソオキサゾール-5-イル) -フェニル	
1355	メチル	3- (チアゾール-2-イル) -フェニル	
1356	メチル	3- (チアゾール-4-イル) -フェニル	
1357	メチル	3- (チアゾール-5-イル) -フェニル	20
1358	メチル	3- (2-メチルチアゾール-4-イル) -フェニル	
1359	メチル	3- (2-メチルチアゾール-5-イル) -フェニル	
1360	メチル	3- ([1, 2, 3] -トリアゾール-1-イル) -フェニル	
1361	メチル	3- ([1, 2, 4] -トリアゾール-1-イル) -フェニル	
1362	メチル	3- ([1, 2, 3] -トリアゾール-2-イル) -フェニル	
1363	メチル	3- (4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル	30
1364	メチル	3- ([1, 2, 4] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
1365	メチル	3- (2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
1366	メチル	3- (4-メチル-4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル	
1367	メチル	3- (2-メチル-2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	40
1368	メチル	3- ([1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル	

1369	メチル	3-(5-メチル-[1, 3, 4]-オキサジアゾール-2-イル)-フェニル	
1370	メチル	3-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
1371	メチル	3-(5-メチル-[1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
1372	メチル	3-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	10
1373	メチル	3-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-フェニル	
1374	メチル	3-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	
1375	メチル	3-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-フェニル	20
1376	メチル	3-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
1377	メチル	3-(テトラゾール-1-イル)-フェニル	
1378	メチル	3-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
1379	メチル	3-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
1380	メチル	3-フラザン-3-イル-フェニル	30
1381	メチル	3-(ピリド-2-イル)-フェニル	
1382	メチル	3-(ピリド-3-イル)-フェニル	
1383	メチル	3-(ピリド-4-イル)-フェニル	
1384	メチル	3-(ピリミジン-2-イル)-フェニル	
1385	メチル	3-(2-メチルピリミジン-4-イル)-フェニル	
1386	メチル	3-(ピリミジン-4-イル)-フェニル	
1387	メチル	3-(ピリミジン-5-イル)-フェニル	40
1388	メチル	5-プロモピリジン-3-イル	
1389	メチル	3-プロモ-2-クロロピリジン-5-イル	

1390	メチル	4-メチルピリジン-2-イル	
1391	メチル	6-メチルピリジン-2-イル	
1392	メチル	4-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル	
1393	メチル	6-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル	
1394	メチル	5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-3-イル	
1395	メチル	5-(ピロリジン-1-イル)-ピリジン-3-イル	
1396	メチル	3-(ピロリジン-1-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	10
1397	メチル	3-(モルホリン-4-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	
1398	メチル	2-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-5-イル	
1399	メチル	2-フェノキシピリジン-5-イル	
1400	メチル	4-メチルフェニル	
1401	メチル	4-エチルフェニル	
1402	メチル	4-プロピルフェニル	
1403	メチル	4-イソプロピルフェニル	20
1404	メチル	4-sec-ブチルフェニル	
1405	メチル	4-tert-ブチルフェニル	
1406	メチル	4-イソブチルフェニル	
1407	メチル	4-(1,1-ジメチルプロピル)-フェニル	
1408	メチル	4-ビニルフェニル	
1409	メチル	4-イソプロペニルフェニル	
1410	メチル	4-フルオロフェニル	30
1411	メチル	4-クロロフェニル	
1412	メチル	4-ブロモフェニル	
1413	メチル	4-ヨードフェニル	
1414	メチル	4-(フルオロメチル)フェニル	
1415	メチル	4-(ジフルオロメチル)フェニル	
1416	メチル	4-(トリフルオロメチル)フェニル	
1417	メチル	2,4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル	40
1418	メチル	4-(1-フルオロエチル)-フェニル	
1419	メチル	4-(S)-1-フルオロエチル)-フェニル	

1420	メチル	4- (R) -1-フルオロエチル) -フェニル	
1421	メチル	4- (2-フルオロエチル) -フェニル	
1422	メチル	4- (1, 1-ジフルオロエチル) -フェニル	
1423	メチル	4- (2, 2-ジフルオロエチル) -フェニル	
1424	メチル	4- (2, 2, 2-トリフルオロエチル) -フェニル	
1425	メチル	4- (3-フルオロプロピル) -フェニル	
1426	メチル	4- (2-フルオロプロピル) -フェニル	10
1427	メチル	4- (S) -2-フルオロプロピル) -フェニル	
1428	メチル	4- (R) -2-フルオロプロピル) -フェニル	
1429	メチル	4- (3, 3-ジフルオロプロピル) -フェニル	
1430	メチル	4- (3, 3, 3-トリフルオロプロピル) -フェニル	
1431	メチル	4- (1-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1432	メチル	4- (2-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1433	メチル	4- (S) -2-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	20
1434	メチル	4- (R) -2-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1435	メチル	4- (2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1436	メチル	4- (S) -2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1437	メチル	4- (R) -2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1438	メチル	4- (2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	30
1439	メチル	4- (S) -2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1440	メチル	4- (R) -2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
1441	メチル	4- (2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル) -フェニル	
1442	メチル	4- (1-ジフルオロメチル-2, 2-ジフルオロエチル) -フェニル	40
1443	メチル	4- (1, 1-ジメチル-2-フルオロエチル) -フェニル	

1444	メチル	4-メトキシフェニル
1445	メチル	4-エトキシフェニル
1446	メチル	4-プロポキシフェニル
1447	メチル	4-イソプロポキシフェニル
1448	メチル	4-ブトキシフェニル
1449	メチル	4-(フルオロメトキシ)フェニル
1450	メチル	4-(ジフルオロメトキシ)フェニル
1451	メチル	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル
1452	メチル	4-(2-フルオロエトキシ)フェニル
1453	メチル	4-(2, 2-ジフルオロエトキシ)フェニル
1454	メチル	4-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)フェニル
1455	メチル	4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェニル
1456	メチル	4-シクロプロピルフェニル
1457	メチル	4-シクロブチルフェニル
1458	メチル	4-シクロペンチルフェニル
1459	メチル	4-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル)フェニル
1460	メチル	3, 4-ジフルオロフェニル
1461	メチル	4-ブロモ-2-フルオロフェニル
1462	メチル	2-ブロモ-4-フルオロフェニル
1463	メチル	4-ブロモ-2, 5-ジフルオロフェニル
1464	メチル	5-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
1465	メチル	3-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
1466	メチル	3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル
1467	メチル	4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル
1468	メチル	3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
1469	メチル	3-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)フェニル
1470	メチル	5-ブロモ-3-(トリフルオロメチル)フェニル
1471	メチル	5-ブロモ-2-(トリフルオロメチル)フェニル
1472	メチル	2-ブロモ-5-メトキシフェニル
1473	メチル	4-ブロモ-3-メトキシフェニル

10

20

30

40

1474	メチル	3-フルオロ-2-イソプロピルフェニル
1475	メチル	3-フルオロ-4-イソプロピルフェニル
1476	メチル	4-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)-フェニル
1477	メチル	4-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-フェニル
1478	メチル	4-アセチルフェニル
1479	メチル	4-アセチルアミノフェニル
1480	メチル	4-カルボキシフェニル
1481	メチル	4-シアノフェニル
1482	メチル	4-ニトロフェニル
1483	メチル	4-ヒドロキシフェニル
1484	メチル	4-(O-ベンジル)-フェニル
1485	メチル	4-(2-メトキシエトキシ)-フェニル
1486	メチル	4-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-フェニル
1487	メチル	4-(NH-CO-NH <sub>2</sub> )-フェニル
1488	メチル	4-(メチルスルファニル)-フェニル
1489	メチル	4-(フルオロメチルスルファニル)-フェニル
1490	メチル	4-(ジフルオロメチルスルファニル)-フェニル
1491	メチル	4-(トリフルオロメチルスルファニル)-フェニル
1492	メチル	4-(メチルスルホニル)-フェニル
1493	メチル	4-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ)-フェニル
1494	メチル	4-(メトシミアミノ)-フェニル
1495	メチル	4-(エトシミアミノ)-フェニル
1496	メチル	4-(N-メチルアミノオキシ)-フェニル
1497	メチル	4-(N,N-ジメチルアミノオキシ)-フェニル
1498	メチル	4-(アゼチジン-1-イル)-フェニル
1499	メチル	4-(2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
1500	メチル	4-((S)-2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
1501	メチル	4-((R)-2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
1502	メチル	4-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)-フェニル
1503	メチル	4-(2,2-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-フェニル

10

20

30

40

1504	メチル	4- (2-メトキシアゼチジン-1-イル) -フェニル	
1505	メチル	4- (3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル) -フェニル	
1506	メチル	4- (ピロリジン-1-イル) -フェニル	
1507	メチル	4- (ピロリジン-2-イル) -フェニル	
1508	メチル	4- ( (S) -ピロリジン-2-イル) -フェニル	
1509	メチル	3- ( (R) -ピロリジン-2-イル) -フェニル	
1510	メチル	4- (ピロリジン-3-イル) -フェニル	10
1511	メチル	4- ( (S) -ピロリジン-3-イル) -フェニル	
1512	メチル	4- ( (R) -ピロリジン-3-イル) -フェニル	
1513	メチル	4- (ピロリジン-1-イル) -5- (トリフルオロメチル) - フェニル	
1514	メチル	4- (ピロリジン-1-イル) -2-メトキシフェニル	
1515	メチル	4- (ピロリジン-1-イル) -3,4-メトキシフェニル	
1516	メチル	4- (ピロリジン-1-イル) -2, 5-ジフルオロフェニル	20
1517	メチル	4- (ピロリジン-1-イル) -2, 6-ジフルオロフェニル	
1518	メチル	4- (2-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
1519	メチル	4- ( (S) -2-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
1520	メチル	4- ( (R) -2-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
1521	メチル	4- (3-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	30
1522	メチル	4- ( (S) -3-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
1523	メチル	4- ( (R) -3-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
1524	メチル	4- (2, 2-ジフルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
1525	メチル	4- (3, 3-ジフルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
1526	メチル	4- (2-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル	40
1527	メチル	4- ( (S) -2-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
1528	メチル	4- ( (R) -2-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル	

1529	メチル	4-(3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
1530	メチル	4-((S)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
1531	メチル	4-((R)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
1532	メチル	4-(1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
1533	メチル	4-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
1534	メチル	4-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
1535	メチル	4-(1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	10
1536	メチル	4-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
1537	メチル	4-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
1538	メチル	4-(2,2-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
1539	メチル	4-(3,3-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
1540	メチル	4-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
1541	メチル	4-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	20
1542	メチル	4-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
1543	メチル	4-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
1544	メチル	4-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	30
1545	メチル	4-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
1546	メチル	4-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル	
1547	メチル	4-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル	
1548	メチル	4-(ピペリジン-1-イル)-フェニル	
1549	メチル	4-(2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
1550	メチル	4-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	40
1551	メチル	4-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
1552	メチル	4-(2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	

1553	メチル	4-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル
1554	メチル	4-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル
1555	メチル	4-(2,2-ジフルオロピペリジン-1-イル)-フェニル
1556	メチル	4-(ピペラジン-1-イル)-フェニル
1557	メチル	4-(4-メチルピペラジン-1-イル)-フェニル
1558	メチル	4-(モルホリン-4-イル)-フェニル
1559	メチル	4-(モルホリン-4-イル)-5-(トリフルオロメチル)-フェニル
1560	メチル	4-(モルホリン-4-イル)-2-メトキシフェニル
1561	メチル	4-(モルホリン-4-イル)-3-メトキシフェニル
1562	メチル	4-(モルホリン-4-イル)-2,5-ジフルオロフェニル
1563	メチル	4-(モルホリン-4-イル)-2,6-ジフルオロフェニル
1564	メチル	4-(チオモルホリン-4-イル)-フェニル
1565	メチル	4-(1-オキソチオモルホリン-4-イル)-フェニル
1566	メチル	4-(1,1-ジオキソチオモルホリン-4-イル)-フェニル
1567	メチル	4-(ピロール-1-イル)-フェニル
1568	メチル	4-(ピロール-2-イル)-フェニル
1569	メチル	4-(ピロール-3-イル)-フェニル
1570	メチル	4-(1-メチルピロール-2-イル)-フェニル
1571	メチル	4-(1-メチルピロール-3-イル)-フェニル
1572	メチル	4-(フラン-2-イル)-フェニル
1573	メチル	4-(フラン-3-イル)-フェニル
1574	メチル	4-(チオフエン-2-イル)-フェニル
1575	メチル	4-(チオフエン-3-イル)-フェニル
1576	メチル	4-(5-プロピルチエン-2-イル)-フェニル
1577	メチル	4-(ピラゾール-1-イル)-フェニル
1578	メチル	4-(ピラゾール-3-イル)-フェニル
1579	メチル	4-(ピラゾール-4-イル)-フェニル
1580	メチル	4-(4-フルオロピラゾール-1-イル)-フェニル
1581	メチル	4-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル

10

20

30

40

1582	メチル	4- (1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル	
1583	メチル	4- (1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) -フェニル	
1584	メチル	4- (1H-イミダゾール-2-イル) -フェニル	
1585	メチル	4- (イミダゾール-1-イル) -フェニル	
1586	メチル	4- (1-メチルイミダゾール-2-イル) -フェニル	
1587	メチル	4- (オキサゾール-2-イル) -フェニル	
1588	メチル	4- (オキサゾール-4-イル) -フェニル	10
1589	メチル	4- (オキサゾール-5-イル) -フェニル	
1590	メチル	4- (イソオキサゾール-3-イル) -フェニル	
1591	メチル	4- (イソオキサゾール-4-イル) -フェニル	
1592	メチル	3- (イソオキサゾール-5-イル) -フェニル	
1593	メチル	4- (チアゾール-2-イル) -フェニル	
1594	メチル	4- (チアゾール-4-イル) -フェニル	20
1595	メチル	4- (チアゾール-5-イル) -フェニル	
1596	メチル	4- (2-メチルチアゾール-4-イル) -フェニル	
1597	メチル	4- (2-メチルチアゾール-5-イル) -フェニル	
1598	メチル	4- ([1, 2, 3] -トリアゾール-1-イル) -フェニル	
1599	メチル	4- ([1, 2, 4] -トリアゾール-1-イル) -フェニル	
1600	メチル	4- ([1, 2, 3] -トリアゾール-2-イル) -フェニル	
1601	メチル	4- (4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル	30
1602	メチル	4- ([1, 2, 4] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
1603	メチル	4- (2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
1604	メチル	4- (4-メチル-4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル	
1605	メチル	4- (2-メチル-2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	40
1606	メチル	4- ([1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル	

1607	メチル	4-(5-メチル-[1, 3, 4]-オキサジアゾール-2-イル)-フェニル	
1608	メチル	4-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
1609	メチル	4-(5-メチル-[1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
1610	メチル	4-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	10
1611	メチル	4-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-フェニル	
1612	メチル	4-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	
1613	メチル	4-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-フェニル	20
1614	メチル	4-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
1615	メチル	4-(テトラゾール-1-イル)-フェニル	
1616	メチル	4-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
1617	メチル	4-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
1618	メチル	4-フラザン-3-イル-フェニル	30
1619	メチル	4-(ピリド-2-イル)-フェニル	
1620	メチル	4-(ピリド-3-イル)-フェニル	
1621	メチル	4-(ピリド-4-イル)-フェニル	
1622	メチル	4-(ピリミジン-2-イル)-フェニル	
1623	メチル	4-(2-メチルピリミジン-4-イル)-フェニル	
1624	メチル	4-(ピリミジン-4-イル)-フェニル	
1625	メチル	4-(ピリミジン-5-イル)-フェニル	40
1626	メチル	4-プロモ-2-クロロピリジン-5-イル	
1627	メチル	4-メチルピリジン-2-イル	

1628	メチル	5-メチルピリジン-2-イル
1629	メチル	4-(ピロリジン-1-イル)-2-クロロピリジン-5-イル
1630	メチル	4-(モルホリン-4-イル)-2-クロロピリジン-5-イル
1631	メチル	2-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-5-イル
1632	メチル	5-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-2-イル
1633	メチル	2-フェノキシピリジン-5-イル
1634	メチル	2,3-ジクロロフェニル
1635	メチル	2,5-ジクロロフェニル
1636	メチル	3,5-ジクロロフェニル
1637	メチル	3-クロロ-4-フルオロフェニル
1638	メチル	4-ブロモ-2,5-ジクロロフェニル
1639	メチル	3-ブロモ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル
1640	メチル	3,5-ジブロモ-4-(2-フルオロエトキシ)-フェニル
1641	メチル	2,5-ジメチルフェニル
1642	メチル	2,5-ジ-(トリフルオロメチル)-フェニル
1643	メチル	3,5-ジ-(トリフルオロメチル)-フェニル
1644	メチル	2,5-ジメトキシフェニル
1645	メチル	2-メトキシ-5-メチルフェニル
1646	メチル	2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)-フェニル
1647	メチル	4-フルオロ-3-(オキサゾール-4-イル)-フェニル
1648	メチル	チエン-2-イル
1649	メチル	チエン-3-イル
1650	メチル	3-クロロチエン-2-イル
1651	メチル	4-クロロチエン-2-イル
1652	メチル	5-クロロチエン-2-イル
1653	メチル	3-ブロモチエン-2-イル
1654	メチル	4-ブロモチエン-2-イル
1655	メチル	5-ブロモチエン-2-イル
1656	メチル	4,5-ジクロロチエン-2-イル
1657	メチル	4,5-ジブロモチエン-2-イル

10

20

30

40

1658	メチル	4-ブロモ-5-クロロチエン-2-イル	
1659	メチル	3-ブロモ-5-クロロチエン-2-イル	
1660	メチル	5-メチルチエン-2-イル	
1661	メチル	5-エチルチエン-2-イル	
1662	メチル	5-プロピルチエン-2-イル	
1663	メチル	5-トリフルオロメチルチエン-2-イル	
1664	メチル	5-フェニルチエン-2-イル	10
1665	メチル	5-(ピリド-2-イル)-チエン-2-イル	
1666	メチル	5-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル	
1667	メチル	4-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル	
1668	メチル	5-(ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル	
1669	メチル	5-(3-クロロ-5-トリフルオロ-ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル	20
1670	メチル	5-(ベンゾイルアミノメチル)-チエン-2-イル	
1671	メチル	5-((4-クロロベンゾイル)アミノメチル)-チエン-2-イル	
1672	メチル	5-(アセチルアミノメチル)-チエン-2-イル	
1673	メチル	5-(ピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル	
1674	メチル	5-(ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル	
1675	メチル	5-(ピラゾール-4-イル)-チエン-2-イル	
1676	メチル	5-(ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル	30
1677	メチル	5-(4-フルオロピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル	
1678	メチル	5-(1-メチル-5-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル	
1679	メチル	5-(1-メチル-3-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル	
1680	メチル	5-(4-カルボキシ-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル	40
1681	メチル	5-(4-アミノメチル-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル	

1682	メチル	5- (イソオキサゾール-3-イル) -チエン-2-イル
1683	メチル	5- (イソオキサゾール-4-イル) -チエン-2-イル
1684	メチル	5- (イソオキサゾール-5-イル) -チエン-2-イル
1685	メチル	5- (5-トリフルオロメチルイソオキサゾール-3-イル) -チエン-2-イル
1686	メチル	5- (オキサゾール-2-イル) -チエン-2-イル
1687	メチル	5- (オキサゾール-4-イル) -チエン-2-イル
1688	メチル	5- (オキサゾール-5-イル) -チエン-2-イル
1689	メチル	5- (2-メチルオキサゾール-4-イル) -チエン-2-イル
1690	メチル	5- (2-メチルオキサゾール-5-イル) -チエン-2-イル
1691	メチル	5- (イソチアゾール-3-イル) -チエン-2-イル
1692	メチル	5- (イソチアゾール-4-イル) -チエン-2-イル
1693	メチル	5- (イソチアゾール-5-イル) -チエン-2-イル
1694	メチル	5- (5-トリフルオロメチルイソチアゾール-3-イル) -チエン-2-イル
1695	メチル	5- (チアゾール-2-イル) -チエン-2-イル
1696	メチル	5- (チアゾール-4-イル) -チエン-2-イル
1697	メチル	5- (チアゾール-5-イル) -チエン-2-イル
1698	メチル	5- (2-メチルチアゾール-4-イル) -チエン-2-イル
1699	メチル	5- (2-メチルチアゾール-5-イル) -チエン-2-イル
1700	メチル	5- ([1, 2, 3] -オキサジアゾール-4-イル) -チエン-2-イル
1701	メチル	5- ([1, 2, 3] -チアジアゾール-4-イル) -チエン-2-イル
1702	メチル	5- (ピリミジン-2-イル) -チエン-2-イル
1703	メチル	5- (ピリミジン-4-イル) -チエン-2-イル
1704	メチル	5- (ピリミジン-5-イル) -チエン-2-イル
1705	メチル	5- (2-メチルチオピリミジン-4-イル) -チエン-2-イル

10

20

30

40

1706	メチル	5- ([1, 3] -ジオキソラン-2-イル) -チエン-2-イル	
1707	メチル	5- ([1, 3] -ジオキソラン-2-イル) -チエン-2-イル ルチエン-2-イル	
1708	メチル	5- ( (3-クロロ-5- (トリフルオロメチル) -ピリジン- 2-イル) -メチル) -チエン-2-イル	
1709	メチル	5- [3-クロロ-5- (トリフルオロメチル) -ピリド-2- イルスルホニル] -チエン-2-イル	10
1710	メチル	2-クロロチエン-3-イル	
1711	メチル	4-クロロチエン-3-イル	
1712	メチル	5-クロロチエン-3-イル	
1713	メチル	2-ブロモチエン-3-イル	
1714	メチル	4-ブロモチエン-3-イル	
1715	メチル	5-ブロモチエン-3-イル	20
1716	メチル	2, 5-ジクロロチエン-3-イル	
1717	メチル	2, 5-ジブロモチエン-3-イル	
1718	メチル	2, 4, 5-トリクロロチエン-3-イル	
1719	メチル	4-プロモ-2, 5-ジクロロチエン-3-イル	
1720	メチル	2-クロロ-5-メチルスルホニルチエン-3-イル	
1721	メチル	2, 5-ジメチルチエン-3-イル	
1722	メチル	4-ヒドロキシチエン-3-イル	30
1723	メチル	2-フェニルチエン-3-イル	
1724	メチル	4-フェニル-5- (トリフルオロメチル) -チエン-3-イル	
1725	メチル	2-メトキシカルボニル-4-フェニル-5- (トリフルオロメ チル) -チエン-3-イル	
1726	メチル	ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
1727	メチル	ベンゾ [b] チオフェン-3-イル	
1728	メチル	3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	40
1729	メチル	5-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	

1730	メチル	5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
1731	メチル	5-クロロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
1732	メチル	5-ブロモ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
1733	H	3-メチルフェニル
1734	H	3-エチルフェニル
1735	H	3-プロピルフェニル
1736	H	3-イソプロピルフェニル
1737	H	3-sec-ブチルフェニル
1738	H	3-tert-ブチルフェニル
1739	H	3-イソブチルフェニル
1740	H	3-(1,1-ジメチルプロピル)-フェニル
1741	H	3-ビニルフェニル
1742	H	3-イソプロペニルフェニル
1743	H	3-フルオロフェニル
1744	H	2-フルオロフェニル
1745	H	3-クロロフェニル
1746	H	3-ブロモフェニル
1747	H	3-ヨードフェニル
1748	H	3-(フルオロメチル)フェニル
1749	H	3-(ジフルオロメチル)フェニル
1750	H	3-(トリフルオロメチル)フェニル
1751	H	3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル
1752	H	3-(1-フルオロエチル)-フェニル
1753	H	3-((S)-1-フルオロエチル)-フェニル
1754	H	3-((R)-1-フルオロエチル)-フェニル
1755	H	3-(2-フルオロエチル)-フェニル
1756	H	3-(1,1-ジフルオロエチル)-フェニル
1757	H	3-(2,2-ジフルオロエチル)-フェニル
1758	H	3-(2,2,2-トリフルオロエチル)-フェニル
1759	H	3-(3-フルオロプロピル)-フェニル

10

20

30

40

1760	H	3-(2-フルオロプロピル)-フェニル
1761	H	3-((S)-2-フルオロプロピル)-フェニル
1762	H	3-((R)-2-フルオロプロピル)-フェニル
1763	H	3-(3,3-ジフルオロプロピル)-フェニル
1764	H	3-(3,3,3-トリフルオロプロピル)-フェニル
1765	H	3-(1-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
1766	H	3-(2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
1767	H	3-((S)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
1768	H	3-((R)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
1769	H	3-(2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
1770	H	3-((S)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
1771	H	3-((R)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
1772	H	3-(2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
1773	H	3-((S)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
1774	H	3-((R)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
1775	H	3-(2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル)-フェニル
1776	H	3-(1-ジフルオロメチル-2,2-ジフルオロエチル)-フェニル
1777	H	3-(1,1-ジメチル-2-フルオロエチル)-フェニル
1778	H	3-メトキシフェニル
1779	H	3-エトキシフェニル
1780	H	3-プロポキシフェニル
1781	H	3-イソプロポキシフェニル
1782	H	3-ブトキシフェニル
1783	H	3-(フルオロメトキシ)-フェニル

10

20

30

40

1784	H	3- (ジフルオロメトキシ) -フェニル
1785	H	3- (トリフルオロメトキシ) -フェニル
1786	H	3- (2-フルオロエトキシ) -フェニル
1787	H	3- (2, 2-ジフルオロエトキシ) -フェニル
1788	H	3- (2, 2, 2-トリフルオロエトキシ) -フェニル
1789	H	3- (1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) -フェニル
1790	H	3-シクロプロピルフェニル
1791	H	3-シクロブチルフェニル
1792	H	3-シクロペンチルフェニル
1793	H	3- (2, 2-ジフルオロシクロプロピル) -フェニル
1794	H	3, 4-ジフルオロフェニル
1795	H	3-ブロモ-2-フルオロフェニル
1796	H	2-ブロモ-3-フルオロフェニル
1797	H	3-ブロモ-2, 5-ジフルオロフェニル
1798	H	5-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
1799	H	3-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
1800	H	4-クロロ-3- (トリフルオロメチル) -フェニル
1801	H	2-クロロ-5- (トリフルオロメチル) -フェニル
1802	H	2-フルオロ-5- (トリフルオロメチル) -フェニル
1803	H	4-フルオロ-3- (トリフルオロメチル) -フェニル
1804	H	3-フルオロ-5- (トリフルオロメチル) -フェニル
1805	H	4-ブロモ-3- (トリフルオロメチル) -フェニル
1806	H	3-ブロモ-5- (トリフルオロメチル) -フェニル
1807	H	2-ブロモ-5- (トリフルオロメチル) -フェニル
1808	H	5-ブロモ-2-メトキシフェニル
1809	H	3-ブロモ-4-メトキシフェニル
1810	H	2-フルオロ-2-イソプロピルフェニル
1811	H	4-フルオロ-3-イソプロピルフェニル
1812	H	3- (1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) -フェニル
1813	H	3- (2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) -フェニル

10

20

30

40

1814	H	3-アセチルフェニル
1815	H	3-アセチルアミノフェニル
1816	H	3-カルボキシフェニル
1817	H	3-シアノフェニル
1818	H	3-ニトロフェニル
1819	H	3-ヒドロキシフェニル
1820	H	3-(O-ベンジル) -フェニル
1821	H	3-(2-メトキシエトキシ) -フェニル
1822	H	3-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ) -フェニル
1823	H	3-(NH-CO-NH <sub>2</sub> ) -フェニル
1824	H	3-(メチルスルファニル) -フェニル
1825	H	3-(フルオロメチルスルファニル) -フェニル
1826	H	3-(ジフルオロメチルスルファニル) -フェニル
1827	H	3-(トリフルオロメチルスルファニル) -フェニル
1828	H	3-(メチルスルホニル) -フェニル
1829	H	3-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ) -フェニル
1830	H	3-(メトキシアミノ) -フェニル
1831	H	3-(エトキシアミノ) -フェニル
1832	H	3-(N-メチルアミノオキシ) -フェニル
1833	H	3-(N, N-ジメチルアミノオキシ) -フェニル
1834	H	3-(アゼチジン-1-イル) -フェニル
1835	H	3-(2-メチルアゼチジン-1-イル) -フェニル
1836	H	3-( (S) -2-メチルアゼチジン-1-イル) -フェニル
1837	H	3-( (R) -2-メチルアゼチジン-1-イル) -フェニル
1838	H	3-(3-フルオロアゼチジン-1-イル) -フェニル
1839	H	3-(2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル) -フェニル
1840	H	3-(2-メトキシアゼチジン-1-イル) -フェニル
1841	H	3-(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル) -フェニル
1842	H	3-(ピロリジン-1-イル) -フェニル
1843	H	3-(ピロリジン-2-イル) -フェニル

10

20

30

40

1844	H	3-((S)-ピロリジン-2-イル)-フェニル
1845	H	3-((R)-ピロリジン-2-イル)-フェニル
1846	H	3-(ピロリジン-3-イル)-フェニル
1847	H	3-((S)-ピロリジン-3-イル)-フェニル
1848	H	3-((R)-ピロリジン-3-イル)-フェニル
1849	H	3-(ピロリジン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)- フェニル
1850	H	5-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル
1851	H	3-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル
1852	H	5-(ピロリジン-1-イル)-2,4-ジフルオロフェニル
1853	H	3-(ピロリジン-1-イル)-2,4-ジフルオロフェニル
1854	H	3-(2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1855	H	3-((S)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1856	H	3-((R)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1857	H	3-(3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1858	H	3-((S)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1859	H	3-((R)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1860	H	3-(2,2-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1861	H	3-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
1862	H	3-(2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1863	H	3-((S)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1864	H	3-((R)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1865	H	3-(3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1866	H	3-((S)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1867	H	3-((R)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1868	H	3-(1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル

10

20

30

40

1869	H	3-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル
1870	H	3-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル
1871	H	3-(1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル
1872	H	3-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル
1873	H	3-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル
1874	H	3-(2,2-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1875	H	3-(3,3-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1876	H	3-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1877	H	3-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1878	H	3-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1879	H	3-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1880	H	3-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1881	H	3-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル
1882	H	3-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル
1883	H	3-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル
1884	H	3-(ピペリジン-1-イル)-フェニル
1885	H	3-(2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル
1886	H	3-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル
1887	H	3-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル
1888	H	3-(2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル
1889	H	3-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル
1890	H	3-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル
1891	H	3-(2,2-ジフルオロピペリジン-1-イル)-フェニル
1892	H	3-(ピペラジン-1-イル)-フェニル

10

20

30

40

1893	H	3- (4-メチルピペラジン-1-イル) -フェニル
1894	H	3- (モルホリン-4-イル) -フェニル
1895	H	3- (モルホリン-4-イル) -5- (トリフルオロメチル) -フェニル
1896	H	5- (モルホリン-4-イル) -2-メトキシフェニル
1897	H	3- (モルホリン-4-イル) -4-メトキシフェニル
1898	H	5- (モルホリン-4-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル
1899	H	3- (モルホリン-4-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル
1900	H	3- (チオモルホリン-4-イル) -フェニル
1901	H	3- (1-オキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル
1902	H	3- (1, 1-ジオキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル
1903	H	3- (ピロール-1-イル) -フェニル
1904	H	3- (ピロール-2-イル) -フェニル
1905	H	3- (ピロール-3-イル) -フェニル
1906	H	3- (1-メチルピロール-2-イル) -フェニル
1907	H	3- (1-メチルピロール-3-イル) -フェニル
1908	H	3- (フラン-2-イル) -フェニル
1909	H	3- (フラン-3-イル) -フェニル
1910	H	3- (チオフエン-2-イル) -フェニル
1911	H	3- (チオフエン-3-イル) -フェニル
1912	H	3- (5-プロピルチエン-2-イル) -フェニル
1913	H	3- (ピラゾール-1-イル) -フェニル
1914	H	3- (ピラゾール-3-イル) -フェニル
1915	H	3- (ピラゾール-4-イル) -フェニル
1916	H	3- (4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル
1917	H	3- (1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
1918	H	3- (1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
1919	H	3- (1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) -フェニル
1920	H	3- (1H-イミダゾール-2-イル) -フェニル
1921	H	3- (イミダゾール-1-イル) -フェニル

10

20

30

40

1922	H	3- (1-メチルイミダゾール-2-イル) -フェニル
1923	H	3- (オキサゾール-2-イル) -フェニル
1924	H	3- (オキサゾール-4-イル) -フェニル
1925	H	3- (オキサゾール-5-イル) -フェニル
1926	H	3- (イソオキサゾール-3-イル) -フェニル
1927	H	3- (イソオキサゾール-4-イル) -フェニル
1928	H	3- (イソオキサゾール-5-イル) -フェニル
1929	H	3- (チアゾール-2-イル) -フェニル
1930	H	3- (チアゾール-4-イル) -フェニル
1931	H	3- (チアゾール-5-イル) -フェニル
1932	H	3- (2-メチルチアゾール-4-イル) -フェニル
1933	H	3- (2-メチルチアゾール-5-イル) -フェニル
1934	H	3- ([1, 2, 3] -トリアゾール-1-イル) -フェニル
1935	H	3- ([1, 2, 4] -トリアゾール-1-イル) -フェニル
1936	H	3- ([1, 2, 3] -トリアゾール-2-イル) -フェニル
1937	H	3- (4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル
1938	H	3- ([1, 2, 4] -トリアゾール-4-イル) -フェニル
1939	H	3- (2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル
1940	H	3- (4-メチル-4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル
1941	H	3- (2-メチル-2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル
1942	H	3- ([1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル
1943	H	3- (5-メチル- [1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル
1944	H	3- ([1, 2, 4] -オキサジアゾール-3-イル) -フェニル

10

20

30

40

1945	H	3-(5-メチル-[1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
1946	H	3-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	
1947	H	3-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-フェニル	
1948	H	3-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	10
1949	H	3-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-フェニル	
1950	H	3-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
1951	H	3-(テトラゾール-1-イル)-フェニル	
1952	H	3-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	20
1953	H	3-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
1954	H	3-フラザン-3-イル-フェニル	
1955	H	3-(ピリド-2-イル)-フェニル	
1956	H	3-(ピリド-3-イル)-フェニル	
1957	H	3-(ピリド-4-イル)-フェニル	
1958	H	3-(ピリミジン-2-イル)-フェニル	30
1959	H	3-(2-メチルピリミジン-4-イル)-フェニル	
1960	H	3-(ピリミジン-4-イル)-フェニル	
1961	H	3-(ピリミジン-5-イル)-フェニル	
1962	H	5-プロモピリジン-3-イル	
1963	H	3-プロモ-2-クロロピリジン-5-イル	
1964	H	4-メチルピリジン-2-イル	
1965	H	6-メチルピリジン-2-イル	40
1966	H	4-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル	
1967	H	6-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル	

1968	H	5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-3-イル
1969	H	5-(ピロリジン-1-イル)-ピリジン-3-イル
1970	H	3-(ピロリジン-1-イル)-2-クロロピリジン-5-イル
1971	H	3-(モルホリン-4-イル)-2-クロロピリジン-5-イル
1972	H	2-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-5-イル
1973	H	2-フェノキシピリジン-5-イル
1974	H	4-メチルフェニル
1975	H	4-エチルフェニル
1976	H	4-プロピルフェニル
1977	H	4-イソプロピルフェニル
1978	H	4-sec-ブチルフェニル
1979	H	4-tert-ブチルフェニル
1980	H	4-イソブチルフェニル
1981	H	4-(1,1-ジメチルプロピル)-フェニル
1982	H	4-ビニルフェニル
1983	H	4-イソプロペニルフェニル
1984	H	4-フルオロフェニル
1985	H	4-クロロフェニル
1986	H	4-ブロモフェニル
1987	H	4-ヨードフェニル
1988	H	4-(フルオロメチル)フェニル
1989	H	4-(ジフルオロメチル)フェニル
1990	H	4-(トリフルオロメチル)フェニル
1991	H	2,4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル
1992	H	4-(1-フルオロエチル)-フェニル
1993	H	4-((S)-1-フルオロエチル)-フェニル
1994	H	4-((R)-1-フルオロエチル)-フェニル
1995	H	4-(2-フルオロエチル)-フェニル
1996	H	4-(1,1-ジフルオロエチル)-フェニル
1997	H	4-(2,2-ジフルオロエチル)-フェニル

10

20

30

40

1998	H	4- (2, 2, 2-トリフルオロエチル) -フェニル	
1999	H	4- (3-フルオロプロピル) -フェニル	
2000	H	4- (2-フルオロプロピル) -フェニル	
2001	H	4- ( (S) -2-フルオロプロピル) -フェニル	
2002	H	4- ( (R) -2-フルオロプロピル) -フェニル	
2003	H	4- (3, 3-ジフルオロプロピル) -フェニル	
2004	H	4- (3, 3, 3-トリフルオロプロピル) -フェニル	10
2005	H	4- (1-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
2006	H	4- (2-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
2007	H	4- ( (S) -2-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
2008	H	4- ( (R) -2-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
2009	H	4- (2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
2010	H	4- ( (S) -2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	20
2011	H	4- ( (R) -2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
2012	H	4- (2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
2013	H	4- ( (S) -2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
2014	H	4- ( (R) -2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	30
2015	H	4- (2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル) -フェニル	
2016	H	4- (1-ジフルオロメチル-2, 2-ジフルオロエチル) -フェニル	
2017	H	4- (1, 1-ジメチル-2-フルオロエチル) -フェニル	
2018	H	4-メトキシフェニル	
2019	H	4-エトキシフェニル	40
2020	H	4-プロポキシフェニル	
2021	H	4-イソプロポキシフェニル	

2022	H	4-ブトキシフェニル	
2023	H	4-(フルオロメトキシ)フェニル	
2024	H	4-(ジフルオロメトキシ)フェニル	
2025	H	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル	
2026	H	4-(2-フルオロエトキシ)フェニル	
2027	H	4-(2, 2-ジフルオロエトキシ)フェニル	
2028	H	4-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)フェニル	10
2029	H	4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェニル	
2030	H	4-シクロプロピルフェニル	
2031	H	4-シクロブチルフェニル	
2032	H	4-シクロペンチルフェニル	
2033	H	4-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル)フェニル	
2034	H	3, 4-ジフルオロフェニル	20
2035	H	4-ブロモ-2-フルオロフェニル	
2036	H	2-ブロモ-4-フルオロフェニル	
2037	H	4-ブロモ-2, 5-ジフルオロフェニル	
2038	H	5-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル	
2039	H	3-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル	
2040	H	3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル	
2041	H	4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル	
2042	H	3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル	30
2043	H	3-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)フェニル	
2044	H	5-ブロモ-3-(トリフルオロメチル)フェニル	
2045	H	5-ブロモ-2-(トリフルオロメチル)フェニル	
2046	H	2-ブロモ-5-メトキシフェニル	
2047	H	4-ブロモ-3-メトキシフェニル	
2048	H	3-フルオロ-2-イソプロピルフェニル	
2049	H	3-フルオロ-4-イソプロピルフェニル	40
2050	H	4-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル	
2051	H	4-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)フェニル	

2052	H	4-アセチルフェニル
2053	H	4-アセチルアミノフェニル
2054	H	4-カルボキシフェニル
2055	H	4-シアノフェニル
2056	H	4-ニトロフェニル
2057	H	4-ヒドロキシフェニル
2058	H	4-(O-ベンジル) -フェニル
2059	H	4-(2-メトキシエトキシ) -フェニル
2060	H	4-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ) -フェニル
2061	H	4-(NH-CO-NH <sub>2</sub> ) -フェニル
2062	H	4-(メチルスルファニル) -フェニル
2063	H	4-(フルオロメチルスルファニル) -フェニル
2064	H	4-(ジフルオロメチルスルファニル) -フェニル
2065	H	4-(トリフルオロメチルスルファニル) -フェニル
2066	H	4-(メチルスルホニル) -フェニル
2067	H	4-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ) -フェニル
2068	H	4-(メトシミアミノ) -フェニル
2069	H	4-(エトシミアミノ) -フェニル
2070	H	4-(N-メチルアミノオキシ) -フェニル
2071	H	4-(N, N-ジメチルアミノオキシ) -フェニル
2072	H	4-(アゼチジン-1-イル) -フェニル
2073	H	4-(2-メチルアゼチジン-1-イル) -フェニル
2074	H	4-( (S) -2-メチルアゼチジン-1-イル) -フェニル
2075	H	4-( (R) -2-メチルアゼチジン-1-イル) -フェニル
2076	H	4-(3-フルオロアゼチジン-1-イル) -フェニル
2077	H	4-(2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル) -フェニル
2078	H	4-(2-メトシミアゼチジン-1-イル) -フェニル
2079	H	4-(3-ヒドロシミアゼチジン-1-イル) -フェニル
2080	H	4-(ピロリジン-1-イル) -フェニル
2081	H	4-(ピロリジン-2-イル) -フェニル

10

20

30

40

2082	H	4-((S)-ピロリジン-2-イル)-フェニル	
2083	H	3-((R)-ピロリジン-2-イル)-フェニル	
2084	H	4-(ピロリジン-3-イル)-フェニル	
2085	H	4-((S)-ピロリジン-3-イル)-フェニル	
2086	H	4-((R)-ピロリジン-3-イル)-フェニル	
2087	H	4-(ピロリジン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)- フェニル	10
2088	H	4-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル	
2089	H	4-(ピロリジン-1-イル)-3,4-メトキシフェニル	
2090	H	4-(ピロリジン-1-イル)-2,5-ジフルオロフェニル	
2091	H	4-(ピロリジン-1-イル)-2,6-ジフルオロフェニル	
2092	H	4-(2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2093	H	4-((S)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	20
2094	H	4-((R)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2095	H	4-(3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2096	H	4-((S)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2097	H	4-((R)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	30
2098	H	4-(2,2-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2099	H	4-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2100	H	4-(2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2101	H	4-((S)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2102	H	4-((R)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2103	H	4-(3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2104	H	4-((S)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	40
2105	H	4-((R)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2106	H	4-(1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	

2107	H	4-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
2108	H	4-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
2109	H	4-(1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
2110	H	4-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
2111	H	4-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
2112	H	4-(2,2-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	10
2113	H	4-(3,3-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2114	H	4-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2115	H	4-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2116	H	4-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	20
2117	H	4-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2118	H	4-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2119	H	4-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2120	H	4-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル	30
2121	H	4-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル	
2122	H	4-(ピペリジン-1-イル)-フェニル	
2123	H	4-(2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
2124	H	4-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
2125	H	4-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
2126	H	4-(2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
2127	H	4-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
2128	H	4-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	40
2129	H	4-(2,2-ジフルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
2130	H	4-(ピペラジン-1-イル)-フェニル	

2131	H	4- (4-メチルピペラジン-1-イル) -フェニル
2132	H	4- (モルホリン-4-イル) -フェニル
2133	H	4- (モルホリン-4-イル) -5- (トリフルオロメチル) -フェニル
2134	H	4- (モルホリン-4-イル) -2-メトキシフェニル
2135	H	4- (モルホリン-4-イル) -3-メトキシフェニル
2136	H	4- (モルホリン-4-イル) -2, 5-ジフルオロフェニル
2137	H	4- (モルホリン-4-イル) -2, 6-ジフルオロフェニル
2138	H	4- (チオモルホリン-4-イル) -フェニル
2139	H	4- (1-オキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル
2140	H	4- (1, 1-ジオキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル
2141	H	4- (ピロール-1-イル) -フェニル
2142	H	4- (ピロール-2-イル) -フェニル
2143	H	4- (ピロール-3-イル) -フェニル
2144	H	4- (1-メチルピロール-2-イル) -フェニル
2145	H	4- (1-メチルピロール-3-イル) -フェニル
2146	H	4- (フラン-2-イル) -フェニル
2147	H	4- (フラン-3-イル) -フェニル
2148	H	4- (チオフエン-2-イル) -フェニル
2149	H	4- (チオフエン-3-イル) -フェニル
2150	H	4- (5-プロピルチエン-2-イル) -フェニル
2151	H	4- (ピラゾール-1-イル) -フェニル
2152	H	4- (ピラゾール-3-イル) -フェニル
2153	H	4- (ピラゾール-4-イル) -フェニル
2154	H	4- (1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
2155	H	4- (1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
2156	H	4- (1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) -フェニル
2157	H	4- (1H-イミダゾール-2-イル) -フェニル
2158	H	4- (イミダゾール-1-イル) -フェニル
2159	H	4- (1-メチルイミダゾール-2-イル) -フェニル

10

20

30

40

2160	H	4- (オキサゾール-2-イル) -フェニル	
2161	H	4- (オキサゾール-4-イル) -フェニル	
2162	H	4- (オキサゾール-5-イル) -フェニル	
2163	H	4- (イソオキサゾール-3-イル) -フェニル	
2164	H	4- (イソオキサゾール-4-イル) -フェニル	
2165	H	3- (イソオキサゾール-5-イル) -フェニル	
2166	H	4- (チアゾール-2-イル) -フェニル	10
2167	H	4- (チアゾール-4-イル) -フェニル	
2168	H	4- (チアゾール-5-イル) -フェニル	
2169	H	4- (2-メチルチアゾール-4-イル) -フェニル	
2170	H	4- (4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル	
2171	H	4- ([1, 2, 3] -トリアゾール-1-イル) -フェニル	
2172	H	4- ([1, 2, 4] -トリアゾール-1-イル) -フェニル	20
2173	H	4- ([1, 2, 3] -トリアゾール-2-イル) -フェニル	
2174	H	4- (4H-[1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル	
2175	H	4- ([1, 2, 4] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
2176	H	4- (2H-[1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
2177	H	4- (4-メチル-4H-[1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル	30
2178	H	4- (2-メチル-2H-[1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
2179	H	4- ([1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル	
2180	H	4- (5-メチル-[1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル	
2181	H	4- ([1, 2, 4] -オキサジアゾール-3-イル) -フェニル	40

2182	H	4-(5-メチル-[1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
2183	H	4-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	
2184	H	4-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-フェニル	
2185	H	4-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	10
2186	H	4-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-フェニル	
2187	H	4-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
2188	H	4-(テトラゾール-1-イル)-フェニル	
2189	H	4-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	20
2190	H	4-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
2191	H	4-フラザン-3-イル-フェニル	
2192	H	4-(ピリド-2-イル)-フェニル	
2193	H	4-(ピリド-3-イル)-フェニル	
2194	H	4-(ピリド-4-イル)-フェニル	
2195	H	4-(ピリミジン-2-イル)-フェニル	30
2196	H	4-(2-メチルピリミジン-4-イル)-フェニル	
2197	H	4-(ピリミジン-4-イル)-フェニル	
2198	H	4-(ピリミジン-5-イル)-フェニル	
2199	H	4-ブロモ-2-クロロピリジン-5-イル	
2200	H	4-メチルピリジン-2-イル	
2201	H	5-メチルピリジン-2-イル	
2202	H	4-(ピロリジン-1-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	40
2203	H	4-(モルホリン-4-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	

2204	H	2- (モルホリン-4-イル) -ピリジン-5-イル
2205	H	5- (モルホリン-4-イル) -ピリジン-2-イル
2206	H	2-フェノキシピリジン-5-イル
2207	H	2, 3-ジクロロフェニル
2208	H	2, 5-ジクロロフェニル
2209	H	3, 5-ジクロロフェニル
2210	H	3-クロロ-4-フルオロフェニル
2211	H	4-ブロモ-2, 5-ジクロロフェニル
2212	H	3-ブロモ-4- (トリフルオロメトキシ) フェニル
2213	H	3, 5-ジブロモ-4- (2-フルオロエトキシ) -フェニル
2214	H	2, 5-ジメチルフェニル
2215	H	2, 5-ジ- (トリフルオロメチル) -フェニル
2216	H	3, 5-ジ- (トリフルオロメチル) -フェニル
2217	H	2, 5-ジメトキシフェニル
2218	H	2-メトキシ-5-メチルフェニル
2219	H	2-メトキシ-5- (トリフルオロメチル) -フェニル
2220	H	4-フルオロ-3- (オキサゾール-4-イル) -フェニル
2221	H	チエン-2-イル
2222	H	チエン-3-イル
2223	H	3-クロロチエン-2-イル
2224	H	4-クロロチエン-2-イル
2225	H	5-クロロチエン-2-イル
2226	H	3-ブロモチエン-2-イル
2227	H	4-ブロモチエン-2-イル
2228	H	5-ブロモチエン-2-イル
2229	H	4, 5-ジクロロチエン-2-イル
2230	H	4, 5-ジブロモチエン-2-イル
2231	H	4-ブロモ-5-クロロチエン-2-イル
2232	H	3-ブロモ-5-クロロチエン-2-イル
2233	H	5-メチルチエン-2-イル

10

20

30

40

2234	H	5-エチルチエン-2-イル
2235	H	5-プロピルチエン-2-イル
2236	H	5-トリフルオロメチルチエン-2-イル
2237	H	5-フェニルチエン-2-イル
2238	H	5-(ピリド-2-イル)-チエン-2-イル
2239	H	5-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル
2240	H	4-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル
2241	H	5-(ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル
2242	H	5-(3-クロロ-5-トリフルオロ-ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル
2243	H	5-(ベンゾイルアミノメチル)-チエン-2-イル
2244	H	5-(4-クロロベンゾイルアミノメチル)-チエン-2-イル
2245	H	5-(アセチルアミノメチル)-チエン-2-イル
2246	H	5-(ピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル
2247	H	5-(ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
2248	H	5-(ピラゾール-4-イル)-チエン-2-イル
2249	H	5-(ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル
2250	H	5-(4-フルオロピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル
2251	H	5-(1-メチル-5-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
2252	H	5-(1-メチル-3-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル
2253	H	5-(4-カルボキシ-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
2254	H	5-(4-アミノメチル-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
2255	H	5-(イソキサゾール-3-イル)-チエン-2-イル
2256	H	5-(イソキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
2257	H	5-(イソキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル

10

20

30

40

2258	H	5-(5-トリフルオロメチルイソキサゾール-3-イル)- チエン-2-イル
2259	H	5-(オキサゾール-2-イル)-チエン-2-イル
2260	H	5-(オキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
2261	H	5-(オキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル
2262	H	5-(2-メチルオキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
2263	H	5-(2-メチルオキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル
2264	H	5-(イソチアゾール-3-イル)-チエン-2-イル
2265	H	5-(イソチアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
2266	H	5-(イソチアゾール-5-イル)-チエン-2-イル
2267	H	5-(5-トリフルオロメチルイソチアゾール-3-イル)-チ エン-2-イル
2268	H	5-(チアゾール-2-イル)-チエン-2-イル
2269	H	5-(チアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
2270	H	5-(チアゾール-5-イル)-チエン-2-イル
2271	H	5-(2-メチルチアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
2272	H	5-(2-メチルチアゾール-5-イル)-チエン-2-イル
2273	H	5-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-チエン -2-イル
2274	H	5-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-チエン- 2-イル
2275	H	5-(ピリミジン-2-イル)-チエン-2-イル
2276	H	5-(ピリミジン-4-イル)-チエン-2-イル
2277	H	5-(ピリミジン-5-イル)-チエン-2-イル
2278	H	5-(2-メチルチオピリミジン-4-イル)-チエン-2-イ ル
2279	H	5-([1, 3]-ジオキソラン-2-イル)-チエン-2-イ ル
2280	H	5-([1, 3]-ジオキソラン-2-イル)-チエン-2-イ ルチエン-2-イル

10

20

30

40

2281	H	5-(3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル)-メチル)-チエン-2-イル	
2282	H	5-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-ピリド-2-イルスルホニル]-チエン-2-イル	
2283	H	2-クロロチエン-3-イル	
2284	H	4-クロロチエン-3-イル	
2285	H	5-クロロチエン-3-イル	10
2286	H	2-ブロモチエン-3-イル	
2287	H	4-ブロモチエン-3-イル	
2288	H	5-ブロモチエン-3-イル	
2289	H	2, 5-ジクロロチエン-3-イル	
2290	H	2, 5-ジブロモチエン-3-イル	
2291	H	2, 4, 5-トリクロロチエン-3-イル	
2292	H	4-プロモ-2, 5-ジクロロチエン-3-イル	20
2293	H	2-クロロ-5-メチルスルホニルチエン-3-イル	
2294	H	2, 5-ジメチルチエン-3-イル	
2295	H	4-ヒドロキシチエン-3-イル	
2296	H	2-フェニルチエン-3-イル	
2297	H	4-フェニル-5-(トリフルオロメチル)-チエン-3-イル	
2298	H	2-メトキシカルボニル-4-フェニル-5-(トリフルオロメチル)-チエン-3-イル	30
2299	H	ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
2300	H	ベンゾ [b] チオフェン-3-イル	
2301	H	3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
2302	H	5-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
2303	H	5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
2304	H	5-クロロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
2305	H	5-プロモ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	40
2306		3-フルオロプロピル	3-メチルフェニル
2307		3-フルオロプロピル	3-エチルフェニル

2308	3-フルオロプロピル	3-プロピルフェニル
2309	3-フルオロプロピル	3-イソプロピルフェニル
2310	3-フルオロプロピル	3-sec-ブチルフェニル
2311	3-フルオロプロピル	3-tert-ブチルフェニル
2312	3-フルオロプロピル	3-イソブチルフェニル
2313	3-フルオロプロピル	3-(1,1-ジメチルプロピル)フェニル
2314	3-フルオロプロピル	3-ビニルフェニル
2315	3-フルオロプロピル	3-イソプロペニルフェニル
2316	3-フルオロプロピル	3-フルオロフェニル
2317	3-フルオロプロピル	2-フルオロフェニル
2318	3-フルオロプロピル	3-クロロフェニル
2319	3-フルオロプロピル	3-ブロモフェニル
2320	3-フルオロプロピル	3-ヨードフェニル
2321	3-フルオロプロピル	3-(フルオロメチル)フェニル
2322	3-フルオロプロピル	3-(ジフルオロメチル)フェニル
2323	3-フルオロプロピル	3-(トリフルオロメチル)フェニル
2324	3-フルオロプロピル	3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル
2325	3-フルオロプロピル	3-(1-フルオロエチル)フェニル
2326	3-フルオロプロピル	3-(S)-1-フルオロエチル)フェニル
2327	3-フルオロプロピル	3-(R)-1-フルオロエチル)フェニル
2328	3-フルオロプロピル	3-(2-フルオロエチル)フェニル
2329	3-フルオロプロピル	3-(1,1-ジフルオロエチル)フェニル
2330	3-フルオロプロピル	3-(2,2-ジフルオロエチル)フェニル
2331	3-フルオロプロピル	3-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル
2332	3-フルオロプロピル	3-(3-フルオロプロピル)フェニル
2333	3-フルオロプロピル	3-(2-フルオロプロピル)フェニル
2334	3-フルオロプロピル	3-(S)-2-フルオロプロピル)フェニル
2335	3-フルオロプロピル	3-(R)-2-フルオロプロピル)フェニル
2336	3-フルオロプロピル	3-(3,3-ジフルオロプロピル)フェニル
2337	3-フルオロプロピル	3-(3,3,3-トリフルオロプロピル)フェニル

10

20

30

40

2338	3-フルオロプロピル	3-(1-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2339	3-フルオロプロピル	3-(2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2340	3-フルオロプロピル	3-((S)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2341	3-フルオロプロピル	3-((R)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2342	3-フルオロプロピル	3-(2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2343	3-フルオロプロピル	3-((S)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	10
2344	3-フルオロプロピル	3-((R)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2345	3-フルオロプロピル	3-(2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2346	3-フルオロプロピル	3-((S)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2347	3-フルオロプロピル	3-((R)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	20
2348	3-フルオロプロピル	3-(2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル)-フェニル	
2349	3-フルオロプロピル	3-(1-ジフルオロメチル-2,2-ジフルオロエチル)-フェニル	
2350	3-フルオロプロピル	3-(1,1-ジメチル-2-フルオロエチル)-フェニル	
2351	3-フルオロプロピル	3-メトキシフェニル	
2352	3-フルオロプロピル	3-エトキシフェニル	30
2353	3-フルオロプロピル	3-プロポキシフェニル	
2354	3-フルオロプロピル	3-イソプロポキシフェニル	
2355	3-フルオロプロピル	3-ブトキシフェニル	
2356	3-フルオロプロピル	3-(フルオロメトキシ)-フェニル	
2357	3-フルオロプロピル	3-(ジフルオロメトキシ)-フェニル	
2358	3-フルオロプロピル	3-(トリフルオロメトキシ)-フェニル	
2359	3-フルオロプロピル	3-(2-フルオロエトキシ)-フェニル	40
2360	3-フルオロプロピル	3-(2,2-ジフルオロエトキシ)-フェニル	
2361	3-フルオロプロピル	3-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-フェニル	

2362	3-フルオロプロピル	3-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) -フェニル	
2363	3-フルオロプロピル	3-シクロプロピルフェニル	
2364	3-フルオロプロピル	3-シクロブチルフェニル	
2365	3-フルオロプロピル	3-シクロペンチルフェニル	
2366	3-フルオロプロピル	3-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル) -フェニル	
2367	3-フルオロプロピル	3, 4-ジフルオロフェニル	
2368	3-フルオロプロピル	3-ブロモ-2-フルオロフェニル	10
2369	3-フルオロプロピル	2-ブロモ-3-フルオロフェニル	
2370	3-フルオロプロピル	3-ブロモ-2, 5-ジフルオロフェニル	
2371	3-フルオロプロピル	5-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル	
2372	3-フルオロプロピル	3-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル	
2373	3-フルオロプロピル	4-クロロ-3-(トリフルオロメチル) -フェニル	
2374	3-フルオロプロピル	2-クロロ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル	
2375	3-フルオロプロピル	2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル	20
2376	3-フルオロプロピル	4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル) -フェニル	
2377	3-フルオロプロピル	3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル	
2378	3-フルオロプロピル	4-ブロモ-3-(トリフルオロメチル) -フェニル	
2379	3-フルオロプロピル	3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル	
2380	3-フルオロプロピル	2-ブロモ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル	
2381	3-フルオロプロピル	5-ブロモ-2-メトキシフェニル	
2382	3-フルオロプロピル	3-ブロモ-4-メトキシフェニル	30
2383	3-フルオロプロピル	2-フルオロ-2-イソプロピルフェニル	
2384	3-フルオロプロピル	4-フルオロ-3-イソプロピルフェニル	
2385	3-フルオロプロピル	3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) -フェニル	
2386	3-フルオロプロピル	3-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) -フェニル	
2387	3-フルオロプロピル	3-アセチルフェニル	
2388	3-フルオロプロピル	3-アセチルアミノフェニル	
2389	3-フルオロプロピル	3-カルボキシフェニル	40
2390	3-フルオロプロピル	3-シアノフェニル	
2391	3-フルオロプロピル	3-ニトロフェニル	

2392	3-フルオロプロピル	3-ヒドロキシフェニル
2393	3-フルオロプロピル	3-(O-ベンジル)-フェニル
2394	3-フルオロプロピル	3-(2-メトキシエトキシ)-フェニル
2395	3-フルオロプロピル	3-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-フェニル
2396	3-フルオロプロピル	3-(NH-CO-NH <sub>2</sub> )-フェニル
2397	3-フルオロプロピル	3-(メチルスルファニル)-フェニル
2398	3-フルオロプロピル	3-(フルオロメチルスルファニル)-フェニル
2399	3-フルオロプロピル	3-(ジフルオロメチルスルファニル)-フェニル
2400	3-フルオロプロピル	3-(トリフルオロメチルスルファニル)-フェニル
2401	3-フルオロプロピル	3-(メチルスルホニル)-フェニル
2402	3-フルオロプロピル	3-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ)-フェニル
2403	3-フルオロプロピル	3-(メトキシアミノ)-フェニル
2404	3-フルオロプロピル	3-(エトキシアミノ)-フェニル
2405	3-フルオロプロピル	3-(N-メチルアミノオキシ)-フェニル
2406	3-フルオロプロピル	3-(N, N-ジメチルアミノオキシ)-フェニル
2407	3-フルオロプロピル	3-(アゼチジン-1-イル)-フェニル
2408	3-フルオロプロピル	3-(2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
2409	3-フルオロプロピル	3-( (S) -2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
2410	3-フルオロプロピル	3-( (R) -2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
2411	3-フルオロプロピル	3-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)-フェニル
2412	3-フルオロプロピル	3-(2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-フェニル
2413	3-フルオロプロピル	3-(2-メトキシアゼチジン-1-イル)-フェニル
2414	3-フルオロプロピル	3-(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル)-フェニル
2415	3-フルオロプロピル	3-(ピロリジン-1-イル)-フェニル
2416	3-フルオロプロピル	3-(ピロリジン-2-イル)-フェニル
2417	3-フルオロプロピル	3-( (S) -ピロリジン-2-イル)-フェニル
2418	3-フルオロプロピル	3-( (R) -ピロリジン-2-イル)-フェニル
2419	3-フルオロプロピル	3-(ピロリジン-3-イル)-フェニル
2420	3-フルオロプロピル	3-( (S) -ピロリジン-3-イル)-フェニル
2421	3-フルオロプロピル	3-( (R) -ピロリジン-3-イル)-フェニル

10

20

30

40

2422	3-フルオロプロピル	3-(ピロリジン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-フェニル	
2423	3-フルオロプロピル	5-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル	
2424	3-フルオロプロピル	3-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル	
2425	3-フルオロプロピル	5-(ピロリジン-1-イル)-2,4-ジフルオロフェニル	
2426	3-フルオロプロピル	3-(ピロリジン-1-イル)-2,4-ジフルオロフェニル	
2427	3-フルオロプロピル	3-(2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	10
2428	3-フルオロプロピル	3-((S)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2429	3-フルオロプロピル	3-((R)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2430	3-フルオロプロピル	3-(3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2431	3-フルオロプロピル	3-((S)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	20
2432	3-フルオロプロピル	3-((R)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2433	3-フルオロプロピル	3-(2,2-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2434	3-フルオロプロピル	3-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2435	3-フルオロプロピル	3-(2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2436	3-フルオロプロピル	3-((S)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2437	3-フルオロプロピル	3-((R)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	30
2438	3-フルオロプロピル	3-(3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2439	3-フルオロプロピル	3-((S)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2440	3-フルオロプロピル	3-((R)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2441	3-フルオロプロピル	3-(1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
2442	3-フルオロプロピル	3-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
2443	3-フルオロプロピル	3-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
2444	3-フルオロプロピル	3-(1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	40
2445	3-フルオロプロピル	3-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
2446	3-フルオロプロピル	3-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	

2447	3-フルオロプロピル	3-(2,2-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2448	3-フルオロプロピル	3-(3,3-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2449	3-フルオロプロピル	3-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2450	3-フルオロプロピル	3-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2451	3-フルオロプロピル	3-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	10
2452	3-フルオロプロピル	3-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2453	3-フルオロプロピル	3-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2454	3-フルオロプロピル	3-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	20
2455	3-フルオロプロピル	3-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル	
2456	3-フルオロプロピル	3-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル	
2457	3-フルオロプロピル	3-(ピペリジン-1-イル)-フェニル	
2458	3-フルオロプロピル	3-(2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
2459	3-フルオロプロピル	3-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
2460	3-フルオロプロピル	3-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
2461	3-フルオロプロピル	3-(2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	30
2462	3-フルオロプロピル	3-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
2463	3-フルオロプロピル	3-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
2464	3-フルオロプロピル	3-(2,2-ジフルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
2465	3-フルオロプロピル	3-(ピペラジン-1-イル)-フェニル	
2466	3-フルオロプロピル	3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-フェニル	
2467	3-フルオロプロピル	3-(モルホリン-4-イル)-フェニル	
2468	3-フルオロプロピル	3-(モルホリン-4-イル)-5-(トリフルオロメチル)-フェニル	40
2469	3-フルオロプロピル	5-(モルホリン-4-イル)-2-メトキシフェニル	

2470	3-フルオロプロピル	3-(モルホリン-4-イル)-4-メトキシフェニル
2471	3-フルオロプロピル	5-(モルホリン-4-イル)-2,4-ジフルオロフェニル
2472	3-フルオロプロピル	3-(モルホリン-4-イル)-2,4-ジフルオロフェニル
2473	3-フルオロプロピル	3-(チオモルホリン-4-イル)-フェニル
2474	3-フルオロプロピル	3-(1-オキソ-チオモルホリン-4-イル)-フェニル
2475	3-フルオロプロピル	3-(1,1-ジオキソ-チオモルホリン-4-イル)-フェニル
2476	3-フルオロプロピル	3-(ピロール-1-イル)-フェニル
2477	3-フルオロプロピル	3-(ピロール-2-イル)-フェニル
2478	3-フルオロプロピル	3-(ピロール-3-イル)-フェニル
2479	3-フルオロプロピル	3-(1-メチルピロール-2-イル)-フェニル
2480	3-フルオロプロピル	3-(1-メチルピロール-3-イル)-フェニル
2481	3-フルオロプロピル	3-(フラン-2-イル)-フェニル
2482	3-フルオロプロピル	3-(フラン-3-イル)-フェニル
2483	3-フルオロプロピル	3-(チオフエン-2-イル)-フェニル
2484	3-フルオロプロピル	3-(チオフエン-3-イル)-フェニル
2485	3-フルオロプロピル	3-(5-プロピルチエン-2-イル)-フェニル
2486	3-フルオロプロピル	3-(ピラゾール-1-イル)-フェニル
2487	3-フルオロプロピル	3-(ピラゾール-3-イル)-フェニル
2488	3-フルオロプロピル	3-(ピラゾール-4-イル)-フェニル
2489	3-フルオロプロピル	3-(4-フルオロピラゾール-1-イル)-フェニル
2490	3-フルオロプロピル	3-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル
2491	3-フルオロプロピル	3-(1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル)-フェニル
2492	3-フルオロプロピル	3-(1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-フェニル
2493	3-フルオロプロピル	3-(1H-イミダゾール-2-イル)-フェニル
2494	3-フルオロプロピル	3-(イミダゾール-1-イル)-フェニル
2495	3-フルオロプロピル	3-(1-メチルイミダゾール-2-イル)-フェニル
2496	3-フルオロプロピル	3-(オキサゾール-2-イル)-フェニル
2497	3-フルオロプロピル	3-(オキサゾール-4-イル)-フェニル
2498	3-フルオロプロピル	3-(オキサゾール-5-イル)-フェニル
2499	3-フルオロプロピル	3-(イソオキサゾール-3-イル)-フェニル

10

20

30

40

2500	3-フルオロプロピル	3-(イソオキサゾール-4-イル)-フェニル	
2501	3-フルオロプロピル	3-(イソオキサゾール-5-イル)-フェニル	
2502	3-フルオロプロピル	3-(チアゾール-2-イル)-フェニル	
2503	3-フルオロプロピル	3-(チアゾール-4-イル)-フェニル	
2504	3-フルオロプロピル	3-(チアゾール-5-イル)-フェニル	
2505	3-フルオロプロピル	3-(2-メチルチアゾール-4-イル)-フェニル	
2506	3-フルオロプロピル	3-(2-メチルチアゾール-5-イル)-フェニル	10
2507	3-フルオロプロピル	3-([1, 2, 3]-トリアゾール-1-イル)-フェニル	
2508	3-フルオロプロピル	3-([1, 2, 4]-トリアゾール-1-イル)-フェニル	
2509	3-フルオロプロピル	3-([1, 2, 3]-トリアゾール-2-イル)-フェニル	
2510	3-フルオロプロピル	3-(4H-[1, 2, 4]-トリアゾール-3-イル)-フェニル	
2511	3-フルオロプロピル	3-([1, 2, 4]-トリアゾール-4-イル)-フェニル	20
2512	3-フルオロプロピル	3-(2H-[1, 2, 3]-トリアゾール-4-イル)-フェニル	
2513	3-フルオロプロピル	3-(4-メチル-4H-[1, 2, 4]-トリアゾール-3-イル)-フェニル	
2514	3-フルオロプロピル	3-(2-メチル-2H-[1, 2, 3]-トリアゾール-4-イル)-フェニル	
2515	3-フルオロプロピル	3-([1, 3, 4]-オキサジアゾール-2-イル)-フェニル	30
2516	3-フルオロプロピル	3-(5-メチル-[1, 3, 4]-オキサジアゾール-2-イル)-フェニル	
2517	3-フルオロプロピル	3-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
2518	3-フルオロプロピル	3-(5-メチル-[1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
2519	3-フルオロプロピル	3-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	40

2520	3-フルオロプロピル	3-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-フェニル	
2521	3-フルオロプロピル	3-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	
2522	3-フルオロプロピル	3-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-フェニル	
2523	3-フルオロプロピル	3-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	10
2524	3-フルオロプロピル	3-(テトラゾール-1-イル)-フェニル	
2525	3-フルオロプロピル	3-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
2526	3-フルオロプロピル	3-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
2527	3-フルオロプロピル	3-フラザン-3-イル-フェニル	
2528	3-フルオロプロピル	3-(ピリド-2-イル)-フェニル	20
2529	3-フルオロプロピル	3-(ピリド-3-イル)-フェニル	
2530	3-フルオロプロピル	3-(ピリド-4-イル)-フェニル	
2531	3-フルオロプロピル	3-(ピリミジン-2-イル)-フェニル	
2532	3-フルオロプロピル	3-(2-メチルピリミジン-4-イル)-フェニル	
2533	3-フルオロプロピル	3-(ピリミジン-4-イル)-フェニル	
2534	3-フルオロプロピル	3-(ピリミジン-5-イル)-フェニル	
2535	3-フルオロプロピル	5-プロモピリジン-3-イル	30
2536	3-フルオロプロピル	3-プロモ-2-クロロピリジン-5-イル	
2537	3-フルオロプロピル	4-メチルピリジン-2-イル	
2538	3-フルオロプロピル	6-メチルピリジン-2-イル	
2539	3-フルオロプロピル	4-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル	
2540	3-フルオロプロピル	6-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル	
2541	3-フルオロプロピル	5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-3-イル	
2542	3-フルオロプロピル	5-(ピロリジン-1-イル)-ピリジン-3-イル	40
2543	3-フルオロプロピル	3-(ピロリジン-1-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	

2544	3-フルオロプロピル	3-(モルホリン-4-イル) - 2-クロロピリジン-5-イル
2545	3-フルオロプロピル	2-(モルホリン-4-イル) -ピリジン-5-イル
2546	3-フルオロプロピル	2-フェノキシピリジン-5-イル
2547	3-フルオロプロピル	4-メチルフェニル
2548	3-フルオロプロピル	4-エチルフェニル
2549	3-フルオロプロピル	4-プロピルフェニル
2550	3-フルオロプロピル	4-イソプロピルフェニル
2551	3-フルオロプロピル	4-sec-ブチルフェニル
2552	3-フルオロプロピル	4-tert-ブチルフェニル
2553	3-フルオロプロピル	4-イソブチルフェニル
2554	3-フルオロプロピル	4-(1,1-ジメチルプロピル) -フェニル
2555	3-フルオロプロピル	4-ビニルフェニル
2556	3-フルオロプロピル	4-イソプロペニルフェニル
2557	3-フルオロプロピル	4-フルオロフェニル
2558	3-フルオロプロピル	4-クロロフェニル
2559	3-フルオロプロピル	4-ブロモフェニル
2560	3-フルオロプロピル	4-ヨードフェニル
2561	3-フルオロプロピル	4-(フルオロメチル) フェニル
2562	3-フルオロプロピル	4-(ジフルオロメチル) フェニル
2563	3-フルオロプロピル	4-(トリフルオロメチル) フェニル
2564	3-フルオロプロピル	2,4-ビス(トリフルオロメチル) フェニル
2565	3-フルオロプロピル	4-(1-フルオロエチル) -フェニル
2566	3-フルオロプロピル	4-( (S) -1-フルオロエチル) -フェニル
2567	3-フルオロプロピル	4-( (R) -1-フルオロエチル) -フェニル
2568	3-フルオロプロピル	4-(2-フルオロエチル) -フェニル
2569	3-フルオロプロピル	4-(1,1-ジフルオロエチル) -フェニル
2570	3-フルオロプロピル	4-(2,2-ジフルオロエチル) -フェニル
2571	3-フルオロプロピル	4-(2,2,2-トリフルオロエチル) -フェニル
2572	3-フルオロプロピル	4-(3-フルオロプロピル) -フェニル
2573	3-フルオロプロピル	4-(2-フルオロプロピル) -フェニル

10

20

30

40

2574	3-フルオロプロピル	4-((S)-2-フルオロプロピル)-フェニル	
2575	3-フルオロプロピル	4-((R)-2-フルオロプロピル)-フェニル	
2576	3-フルオロプロピル	4-(3,3-ジフルオロプロピル)-フェニル	
2577	3-フルオロプロピル	4-(3,3,3-トリフルオロプロピル)-フェニル	
2578	3-フルオロプロピル	4-(1-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2579	3-フルオロプロピル	4-(2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2580	3-フルオロプロピル	4-((S)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	10
2581	3-フルオロプロピル	4-((R)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2582	3-フルオロプロピル	4-(2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2583	3-フルオロプロピル	4-((S)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2584	3-フルオロプロピル	4-((R)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	20
2585	3-フルオロプロピル	4-(2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2586	3-フルオロプロピル	4-((S)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2587	3-フルオロプロピル	4-((R)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2588	3-フルオロプロピル	4-(2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル)-フェニル	
2589	3-フルオロプロピル	4-(1-ジフルオロメチル-2,2-ジフルオロエチル)-フェニル	30
2590	3-フルオロプロピル	4-(1,1-ジメチル-2-フルオロエチル)-フェニル	
2591	3-フルオロプロピル	4-メトキシフェニル	
2592	3-フルオロプロピル	4-エトキシフェニル	
2593	3-フルオロプロピル	4-プロポキシフェニル	
2594	3-フルオロプロピル	4-イソプロポキシフェニル	
2595	3-フルオロプロピル	4-ブトキシフェニル	40
2596	3-フルオロプロピル	4-(フルオロメトキシ)-フェニル	
2597	3-フルオロプロピル	4-(ジフルオロメトキシ)-フェニル	

2598	3-フルオロプロピル	4-(トリフルオロメトキシ) -フェニル
2599	3-フルオロプロピル	4-(2-フルオロエトキシ) -フェニル
2600	3-フルオロプロピル	4-(2, 2-ジフルオロエトキシ) -フェニル
2601	3-フルオロプロピル	4-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ) -フェニル
2602	3-フルオロプロピル	4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) -フェニル
2603	3-フルオロプロピル	4-シクロプロピルフェニル
2604	3-フルオロプロピル	4-シクロブチルフェニル
2605	3-フルオロプロピル	4-シクロペンチルフェニル
2606	3-フルオロプロピル	4-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル) -フェニル
2607	3-フルオロプロピル	3, 4-ジフルオロフェニル
2608	3-フルオロプロピル	4-ブロモ-2-フルオロフェニル
2609	3-フルオロプロピル	2-ブロモ-4-フルオロフェニル
2610	3-フルオロプロピル	4-ブロモ-2, 5-ジフルオロフェニル
2611	3-フルオロプロピル	5-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
2612	3-フルオロプロピル	3-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
2613	3-フルオロプロピル	3-クロロ-4-(トリフルオロメチル) -フェニル
2614	3-フルオロプロピル	4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル) -フェニル
2615	3-フルオロプロピル	3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル
2616	3-フルオロプロピル	3-ブロモ-4-(トリフルオロメチル) -フェニル
2617	3-フルオロプロピル	5-ブロモ-3-(トリフルオロメチル) -フェニル
2618	3-フルオロプロピル	5-ブロモ-2-(トリフルオロメチル) -フェニル
2619	3-フルオロプロピル	2-ブロモ-5-メトキシフェニル
2620	3-フルオロプロピル	4-ブロモ-3-メトキシフェニル
2621	3-フルオロプロピル	3-フルオロ-2-イソプロピルフェニル
2622	3-フルオロプロピル	3-フルオロ-4-イソプロピルフェニル
2623	3-フルオロプロピル	4-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) -フェニル
2624	3-フルオロプロピル	4-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) -フェニル
2625	3-フルオロプロピル	4-アセチルフェニル
2626	3-フルオロプロピル	4-アセチルアミノフェニル
2627	3-フルオロプロピル	4-カルボキシフェニル

10

20

30

40

2628	3-フルオロプロピル	4-シアノフェニル
2629	3-フルオロプロピル	4-ニトロフェニル
2630	3-フルオロプロピル	4-ヒドロキシフェニル
2631	3-フルオロプロピル	4-(O-ベンジル)-フェニル
2632	3-フルオロプロピル	4-(2-メトキシエトキシ)-フェニル
2633	3-フルオロプロピル	4-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-フェニル
2634	3-フルオロプロピル	4-(NH-CO-NH <sub>2</sub> )-フェニル
2635	3-フルオロプロピル	4-(メチルスルファニル)-フェニル
2636	3-フルオロプロピル	4-(フルオロメチルスルファニル)-フェニル
2637	3-フルオロプロピル	4-(ジフルオロメチルスルファニル)-フェニル
2638	3-フルオロプロピル	4-(トリフルオロメチルスルファニル)-フェニル
2639	3-フルオロプロピル	4-(メチルスルホニル)-フェニル
2640	3-フルオロプロピル	4-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ)-フェニル
2641	3-フルオロプロピル	4-(メトキシアミノ)-フェニル
2642	3-フルオロプロピル	4-(エトキシアミノ)-フェニル
2643	3-フルオロプロピル	4-(N-メチルアミノオキシ)-フェニル
2644	3-フルオロプロピル	4-(N, N-ジメチルアミノオキシ)-フェニル
2645	3-フルオロプロピル	4-(アゼチジン-1-イル)-フェニル
2646	3-フルオロプロピル	4-(2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
2647	3-フルオロプロピル	4-((S)-2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
2648	3-フルオロプロピル	4-((R)-2-メチルアゼチジン-1-イル)-フェニル
2649	3-フルオロプロピル	4-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)-フェニル
2650	3-フルオロプロピル	4-(2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル)-フェニル
2651	3-フルオロプロピル	4-(2-メトキシアゼチジン-1-イル)-フェニル
2652	3-フルオロプロピル	4-(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル)-フェニル
2653	3-フルオロプロピル	4-(ピロリジン-1-イル)-フェニル
2654	3-フルオロプロピル	4-(ピロリジン-2-イル)-フェニル
2655	3-フルオロプロピル	4-((S)-ピロリジン-2-イル)-フェニル
2656	3-フルオロプロピル	3-((R)-ピロリジン-2-イル)-フェニル
2657	3-フルオロプロピル	4-(ピロリジン-3-イル)-フェニル

10

20

30

40

2658	3-フルオロプロピル	4-((S)-ピロリジン-3-イル)-フェニル	
2659	3-フルオロプロピル	4-((R)-ピロリジン-3-イル)-フェニル	
2660	3-フルオロプロピル	4-(ピロリジン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-フェニル	
2661	3-フルオロプロピル	4-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル	
2662	3-フルオロプロピル	4-(ピロリジン-1-イル)-3,4-メトキシフェニル	
2663	3-フルオロプロピル	4-(ピロリジン-1-イル)-2,5-ジフルオロフェニル	10
2664	3-フルオロプロピル	4-(ピロリジン-1-イル)-2,6-ジフルオロフェニル	
2665	3-フルオロプロピル	4-(2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2666	3-フルオロプロピル	4-((S)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2667	3-フルオロプロピル	4-((R)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2668	3-フルオロプロピル	4-(3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	20
2669	3-フルオロプロピル	4-((S)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2670	3-フルオロプロピル	4-((R)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2671	3-フルオロプロピル	4-(2,2-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2672	3-フルオロプロピル	4-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
2673	3-フルオロプロピル	4-(2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	30
2674	3-フルオロプロピル	4-((S)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2675	3-フルオロプロピル	4-((R)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2676	3-フルオロプロピル	4-(3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2677	3-フルオロプロピル	4-((S)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2678	3-フルオロプロピル	4-((R)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2679	3-フルオロプロピル	4-(1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
2680	3-フルオロプロピル	4-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	40
2681	3-フルオロプロピル	4-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
2682	3-フルオロプロピル	4-(1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	

2683	3-フルオロプロピル	4-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
2684	3-フルオロプロピル	4-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
2685	3-フルオロプロピル	4-(2,2-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2686	3-フルオロプロピル	4-(3,3-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2687	3-フルオロプロピル	4-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2688	3-フルオロプロピル	4-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	10
2689	3-フルオロプロピル	4-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2690	3-フルオロプロピル	4-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2691	3-フルオロプロピル	4-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	20
2692	3-フルオロプロピル	4-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
2693	3-フルオロプロピル	4-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル	
2694	3-フルオロプロピル	4-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル	
2695	3-フルオロプロピル	4-(ピペリジン-1-イル)-フェニル	
2696	3-フルオロプロピル	4-(2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
2697	3-フルオロプロピル	4-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	30
2698	3-フルオロプロピル	4-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
2699	3-フルオロプロピル	4-(2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
2700	3-フルオロプロピル	4-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
2701	3-フルオロプロピル	4-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
2702	3-フルオロプロピル	4-(2,2-ジフルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
2703	3-フルオロプロピル	4-(ピペラジン-1-イル)-フェニル	
2704	3-フルオロプロピル	4-(4-メチルピペラジン-1-イル)-フェニル	40
2705	3-フルオロプロピル	4-(モルホリン-4-イル)-フェニル	

2706	3-フルオロプロピル	4-(モルホリン-4-イル) -5-(トリフルオロメチル) -フェニル	
2707	3-フルオロプロピル	4-(モルホリン-4-イル) -2-メトキシフェニル	
2708	3-フルオロプロピル	4-(モルホリン-4-イル) -3-メトキシフェニル	
2709	3-フルオロプロピル	4-(モルホリン-4-イル) -2, 5-ジフルオロフェニル	
2710	3-フルオロプロピル	4-(モルホリン-4-イル) -2, 6-ジフルオロフェニル	
2711	3-フルオロプロピル	4-(チオモルホリン-4-イル) -フェニル	10
2712	3-フルオロプロピル	4-(1-オキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル	
2713	3-フルオロプロピル	4-(1, 1-ジオキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル	
2714	3-フルオロプロピル	4-(ピロール-1-イル) -フェニル	
2715	3-フルオロプロピル	4-(ピロール-2-イル) -フェニル	
2716	3-フルオロプロピル	4-(ピロール-3-イル) -フェニル	
2717	3-フルオロプロピル	4-(1-メチルピロール-2-イル) -フェニル	
2718	3-フルオロプロピル	4-(1-メチルピロール-3-イル) -フェニル	20
2719	3-フルオロプロピル	4-(フラン-2-イル) -フェニル	
2720	3-フルオロプロピル	4-(フラン-3-イル) -フェニル	
2721	3-フルオロプロピル	4-(チオフエン-2-イル) -フェニル	
2722	3-フルオロプロピル	4-(チオフエン-3-イル) -フェニル	
2723	3-フルオロプロピル	4-(5-プロピルチエン-2-イル) -フェニル	
2724	3-フルオロプロピル	4-(ピラゾール-1-イル) -フェニル	
2725	3-フルオロプロピル	4-(ピラゾール-3-イル) -フェニル	30
2726	3-フルオロプロピル	4-(ピラゾール-4-イル) -フェニル	
2727	3-フルオロプロピル	4-(4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル	
2728	3-フルオロプロピル	4-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル	
2729	3-フルオロプロピル	4-(1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル	
2730	3-フルオロプロピル	4-(1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) -フェニル	
2731	3-フルオロプロピル	4-(1H-イミダゾール-2-イル) -フェニル	
2732	3-フルオロプロピル	4-(イミダゾール-1-イル) -フェニル	40
2733	3-フルオロプロピル	4-(1-メチルイミダゾール-2-イル) -フェニル	

2734	3-フルオロプロピル	4- (オキサゾール-2-イル) -フェニル	
2735	3-フルオロプロピル	4- (オキサゾール-4-イル) -フェニル	
2736	3-フルオロプロピル	4- (オキサゾール-5-イル) -フェニル	
2737	3-フルオロプロピル	4- (イソオキサゾール-3-イル) -フェニル	
2738	3-フルオロプロピル	4- (イソオキサゾール-4-イル) -フェニル	
2739	3-フルオロプロピル	3- (イソオキサゾール-5-イル) -フェニル	
2740	3-フルオロプロピル	4- (チアゾール-2-イル) -フェニル	10
2741	3-フルオロプロピル	4- (チアゾール-4-イル) -フェニル	
2742	3-フルオロプロピル	4- (チアゾール-5-イル) -フェニル	
2743	3-フルオロプロピル	4- (2-メチルチアゾール-4-イル) -フェニル	
2744	3-フルオロプロピル	4- (4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル	
2745	3-フルオロプロピル	4- ([1, 2, 3] -トリアゾール-1-イル) -フェニル	
2746	3-フルオロプロピル	4- ([1, 2, 4] -トリアゾール-1-イル) -フェニル	
2747	3-フルオロプロピル	4- ([1, 2, 3] -トリアゾール-2-イル) -フェニル	20
2748	3-フルオロプロピル	4- (4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル	
2749	3-フルオロプロピル	4- ([1, 2, 4] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
2750	3-フルオロプロピル	4- (2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
2751	3-フルオロプロピル	4- (4-メチル-4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル	30
2752	3-フルオロプロピル	4- (2-メチル-2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
2753	3-フルオロプロピル	4- ([1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル	
2754	3-フルオロプロピル	4- (5-メチル- [1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル	
2755	3-フルオロプロピル	4- ([1, 2, 4] -オキサジアゾール-3-イル) -フェニル	40

2756	3-フルオロプロピル	4-(5-メチル-[1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
2757	3-フルオロプロピル	4-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	
2758	3-フルオロプロピル	4-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-フェニル	
2759	3-フルオロプロピル	4-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	10
2760	3-フルオロプロピル	4-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-フェニル	
2761	3-フルオロプロピル	4-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
2762	3-フルオロプロピル	4-(テトラゾール-1-イル)-フェニル	
2763	3-フルオロプロピル	4-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	20
2764	3-フルオロプロピル	4-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
2765	3-フルオロプロピル	4-フラザン-3-イル-フェニル	
2766	3-フルオロプロピル	4-(ピリド-2-イル)-フェニル	
2767	3-フルオロプロピル	4-(ピリド-3-イル)-フェニル	
2768	3-フルオロプロピル	4-(ピリド-4-イル)-フェニル	
2769	3-フルオロプロピル	4-(ピリミジン-2-イル)-フェニル	30
2770	3-フルオロプロピル	4-(2-メチルピリミジン-4-イル)-フェニル	
2771	3-フルオロプロピル	4-(ピリミジン-4-イル)-フェニル	
2772	3-フルオロプロピル	4-(ピリミジン-5-イル)-フェニル	
2773	3-フルオロプロピル	4-プロモ-2-クロロピリジン-5-イル	
2774	3-フルオロプロピル	4-メチルピリジン-2-イル	
2775	3-フルオロプロピル	5-メチルピリジン-2-イル	
2776	3-フルオロプロピル	4-(ピロリジン-1-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	40
2777	3-フルオロプロピル	4-(モルホリン-4-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	

2778	3-フルオロプロピル	2-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-5-イル
2779	3-フルオロプロピル	5-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-2-イル
2780	3-フルオロプロピル	2-フェノキシピリジン-5-イル
2781	3-フルオロプロピル	2, 3-ジクロロフェニル
2782	3-フルオロプロピル	2, 5-ジクロロフェニル
2783	3-フルオロプロピル	3, 5-ジクロロフェニル
2784	3-フルオロプロピル	3-クロロ-4-フルオロフェニル
2785	3-フルオロプロピル	4-ブロモ-2, 5-ジクロロフェニル
2786	3-フルオロプロピル	3-ブロモ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル
2787	3-フルオロプロピル	3, 5-ジブロモ-4-(2-フルオロエトキシ)-フェニル
2788	3-フルオロプロピル	2, 5-ジメチルフェニル
2789	3-フルオロプロピル	2, 5-ジ-(トリフルオロメチル)-フェニル
2790	3-フルオロプロピル	3, 5-ジ-(トリフルオロメチル)-フェニル
2791	3-フルオロプロピル	2, 5-ジメトキシフェニル
2792	3-フルオロプロピル	2-メトキシ-5-メチルフェニル
2793	3-フルオロプロピル	2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)-フェニル
2794	3-フルオロプロピル	4-フルオロ-3-(オキサゾール-4-イル)-フェニル
2795	3-フルオロプロピル	チエン-2-イル
2796	3-フルオロプロピル	チエン-3-イル
2797	3-フルオロプロピル	3-クロロチエン-2-イル
2798	3-フルオロプロピル	4-クロロチエン-2-イル
2799	3-フルオロプロピル	5-クロロチエン-2-イル
2800	3-フルオロプロピル	3-ブロモチエン-2-イル
2801	3-フルオロプロピル	4-ブロモチエン-2-イル
2802	3-フルオロプロピル	5-ブロモチエン-2-イル
2803	3-フルオロプロピル	4, 5-ジクロロチエン-2-イル
2804	3-フルオロプロピル	4, 5-ジブロモチエン-2-イル
2805	3-フルオロプロピル	4-ブロモ-5-クロロチエン-2-イル
2806	3-フルオロプロピル	3-ブロモ-5-クロロチエン-2-イル
2807	3-フルオロプロピル	5-メチルチエン-2-イル

10

20

30

40

2808	3-フルオロプロピル	5-エチルチエン-2-イル
2809	3-フルオロプロピル	5-プロピルチエン-2-イル
2810	3-フルオロプロピル	5-トリフルオロメチルチエン-2-イル
2811	3-フルオロプロピル	5-フェニルチエン-2-イル
2812	3-フルオロプロピル	5-(ピリド-2-イル)-チエン-2-イル
2813	3-フルオロプロピル	5-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル
2814	3-フルオロプロピル	4-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル
2815	3-フルオロプロピル	5-(ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル
2816	3-フルオロプロピル	5-(3-クロロ-5-トリフルオロ-ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル
2817	3-フルオロプロピル	5-(ベンゾイルアミノメチル)-チエン-2-イル
2818	3-フルオロプロピル	5-(4-クロロベンゾイル)アミノメチル)-チエン-2-イル
2819	3-フルオロプロピル	5-(アセチルアミノメチル)-チエン-2-イル
2820	3-フルオロプロピル	5-(ピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル
2821	3-フルオロプロピル	5-(ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
2822	3-フルオロプロピル	5-(ピラゾール-4-イル)-チエン-2-イル
2823	3-フルオロプロピル	5-(ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル
2824	3-フルオロプロピル	5-(4-フルオロピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル
2825	3-フルオロプロピル	5-(1-メチル-5-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
2826	3-フルオロプロピル	5-(1-メチル-3-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル
2827	3-フルオロプロピル	5-(4-カルボキシ-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
2828	3-フルオロプロピル	5-(4-アミノメチル-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
2829	3-フルオロプロピル	5-(イソキサゾール-3-イル)-チエン-2-イル
2830	3-フルオロプロピル	5-(イソキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
2831	3-フルオロプロピル	5-(イソキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル

10

20

30

40

2832	3-フルオロプロピル	5-(5-トリフルオロメチルイソキサゾール-3-イル) - チエン-2-イル
2833	3-フルオロプロピル	5-(オキサゾール-2-イル) -チエン-2-イル
2834	3-フルオロプロピル	5-(オキサゾール-4-イル) -チエン-2-イル
2835	3-フルオロプロピル	5-(オキサゾール-5-イル) -チエン-2-イル
2836	3-フルオロプロピル	5-(2-メチルオキサゾール-4-イル) -チエン-2-イル
2837	3-フルオロプロピル	5-(2-メチルオキサゾール-5-イル) -チエン-2-イル
2838	3-フルオロプロピル	5-(イソチアゾール-3-イル) -チエン-2-イル
2839	3-フルオロプロピル	5-(イソチアゾール-4-イル) -チエン-2-イル
2840	3-フルオロプロピル	5-(イソチアゾール-5-イル) -チエン-2-イル
2841	3-フルオロプロピル	5-(5-トリフルオロメチルイソチアゾール-3-イル) -チ エン-2-イル
2842	3-フルオロプロピル	5-(チアゾール-2-イル) -チエン-2-イル
2843	3-フルオロプロピル	5-(チアゾール-4-イル) -チエン-2-イル
2844	3-フルオロプロピル	5-(チアゾール-5-イル) -チエン-2-イル
2845	3-フルオロプロピル	5-(2-メチルチアゾール-4-イル) -チエン-2-イル
2846	3-フルオロプロピル	5-(2-メチルチアゾール-5-イル) -チエン-2-イル
2847	3-フルオロプロピル	5-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル) -チエン -2-イル
2848	3-フルオロプロピル	5-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル) -チエン- 2-イル
2849	3-フルオロプロピル	5-(ピリミジン-2-イル) -チエン-2-イル
2850	3-フルオロプロピル	5-(ピリミジン-4-イル) -チエン-2-イル
2851	3-フルオロプロピル	5-(ピリミジン-5-イル) -チエン-2-イル
2852	3-フルオロプロピル	5-(2-メチルチオピリミジン-4-イル) -チエン-2-イ ル
2853	3-フルオロプロピル	5-([1, 3]-ジオキサラン-2-イル) -チエン-2-イ ル
2854	3-フルオロプロピル	5-([1, 3]-ジオキサラン-2-イル) -チエン-2-イ ルチエン-2-イル

10

20

30

40

2855	3-フルオロプロピル	5-(3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル)-メチル)-チエン-2-イル
2856	3-フルオロプロピル	5-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-ピリド-2-イルスルホニル]-チエン-2-イル
2857	3-フルオロプロピル	2-クロロチエン-3-イル
2858	3-フルオロプロピル	4-クロロチエン-3-イル
2859	3-フルオロプロピル	5-クロロチエン-3-イル
2860	3-フルオロプロピル	2-プロモチエン-3-イル
2861	3-フルオロプロピル	4-プロモチエン-3-イル
2862	3-フルオロプロピル	5-プロモチエン-3-イル
2863	3-フルオロプロピル	2, 5-ジクロロチエン-3-イル
2864	3-フルオロプロピル	2, 5-ジプロモチエン-3-イル
2865	3-フルオロプロピル	2, 4, 5-トリクロロチエン-3-イル
2866	3-フルオロプロピル	4-プロモ-2, 5-ジクロロチエン-3-イル
2867	3-フルオロプロピル	2-クロロ-5-メチルスルホニルチエン-3-イル
2868	3-フルオロプロピル	2, 5-ジメチルチエン-3-イル
2869	3-フルオロプロピル	4-ヒドロキシチエン-3-イル
2870	3-フルオロプロピル	2-フェニルチエン-3-イル
2871	3-フルオロプロピル	4-フェニル-5-(トリフルオロメチル)-チエン-3-イル
2872	3-フルオロプロピル	2-メトキシカルボニル-4-フェニル-5-(トリフルオロメチル)-チエン-3-イル
2873	3-フルオロプロピル	ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
2874	3-フルオロプロピル	ベンゾ [b] チオフェン-3-イル
2875	3-フルオロプロピル	3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
2876	3-フルオロプロピル	5-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
2877	3-フルオロプロピル	5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
2878	3-フルオロプロピル	5-クロロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
2879	3-フルオロプロピル	5-プロモ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
2880	2-フルオロエチル	3-メチルフェニル
2881	2-フルオロエチル	3-エチルフェニル

10

20

30

40

2882	2-フルオロエチル	3-プロピルフェニル
2883	2-フルオロエチル	3-イソプロピルフェニル
2884	2-フルオロエチル	3-sec-ブチルフェニル
2885	2-フルオロエチル	3-tert-ブチルフェニル
2886	2-フルオロエチル	3-イソブチルフェニル
2887	2-フルオロエチル	3-(1,1-ジメチルプロピル)-フェニル
2888	2-フルオロエチル	3-ビニルフェニル
2889	2-フルオロエチル	3-イソプロペニルフェニル
2890	2-フルオロエチル	3-フルオロフェニル
2891	2-フルオロエチル	2-フルオロフェニル
2892	2-フルオロエチル	3-クロロフェニル
2893	2-フルオロエチル	3-ブロモフェニル
2894	2-フルオロエチル	3-ヨードフェニル
2895	2-フルオロエチル	3-(フルオロメチル)フェニル
2896	2-フルオロエチル	3-(ジフルオロメチル)フェニル
2897	2-フルオロエチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル
2898	2-フルオロエチル	3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル
2899	2-フルオロエチル	3-(1-フルオロエチル)-フェニル
2900	2-フルオロエチル	3-((S)-1-フルオロエチル)-フェニル
2901	2-フルオロエチル	3-((R)-1-フルオロエチル)-フェニル
2902	2-フルオロエチル	3-(2-フルオロエチル)-フェニル
2903	2-フルオロエチル	3-(1,1-ジフルオロエチル)-フェニル
2904	2-フルオロエチル	3-(2,2-ジフルオロエチル)-フェニル
2905	2-フルオロエチル	3-(2,2,2-トリフルオロエチル)-フェニル
2906	2-フルオロエチル	3-(3-フルオロプロピル)-フェニル
2907	2-フルオロエチル	3-(2-フルオロプロピル)-フェニル
2908	2-フルオロエチル	3-((S)-2-フルオロプロピル)-フェニル
2909	2-フルオロエチル	3-((R)-2-フルオロプロピル)-フェニル
2910	2-フルオロエチル	3-(3,3-ジフルオロプロピル)-フェニル
2911	2-フルオロエチル	3-(3,3,3-トリフルオロプロピル)-フェニル

10

20

30

40

2912	2-フルオロエチル	3-(1-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2913	2-フルオロエチル	3-(2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2914	2-フルオロエチル	3-((S)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2915	2-フルオロエチル	3-((R)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2916	2-フルオロエチル	3-(2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2917	2-フルオロエチル	3-((S)-2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	10
2918	2-フルオロエチル	3-((R)-2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2919	2-フルオロエチル	3-(2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2920	2-フルオロエチル	3-((S)-2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
2921	2-フルオロエチル	3-((R)-2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	20
2922	2-フルオロエチル	3-(2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル)-フェニル	
2923	2-フルオロエチル	3-(1-ジフルオロメチル-2, 2-ジフルオロエチル)-フェニル	
2924	2-フルオロエチル	3-(1, 1-ジメチル-2-フルオロエチル)-フェニル	
2925	2-フルオロエチル	3-メトキシフェニル	
2926	2-フルオロエチル	3-エトキシフェニル	30
2927	2-フルオロエチル	3-プロポキシフェニル	
2928	2-フルオロエチル	3-イソプロポキシフェニル	
2929	2-フルオロエチル	3-ブトキシフェニル	
2930	2-フルオロエチル	3-(フルオロメトキシ)-フェニル	
2931	2-フルオロエチル	3-(ジフルオロメトキシ)-フェニル	
2932	2-フルオロエチル	3-(トリフルオロメトキシ)-フェニル	
2933	2-フルオロエチル	3-(2-フルオロエトキシ)-フェニル	40
2934	2-フルオロエチル	3-(2, 2-ジフルオロエトキシ)-フェニル	
2935	2-フルオロエチル	3-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)-フェニル	

2936	2-フルオロエチル	3-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) -フェニル
2937	2-フルオロエチル	3-シクロプロピルフェニル
2938	2-フルオロエチル	3-シクロブチルフェニル
2939	2-フルオロエチル	3-シクロペンチルフェニル
2940	2-フルオロエチル	3-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル) -フェニル
2941	2-フルオロエチル	3, 4-ジフルオロフェニル
2942	2-フルオロエチル	3-ブロモ-2-フルオロフェニル
2943	2-フルオロエチル	2-ブロモ-3-フルオロフェニル
2944	2-フルオロエチル	3-ブロモ-2, 5-ジフルオロフェニル
2945	2-フルオロエチル	5-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
2946	2-フルオロエチル	3-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
2947	2-フルオロエチル	4-クロロ-3-(トリフルオロメチル) -フェニル
2948	2-フルオロエチル	2-クロロ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル
2949	2-フルオロエチル	2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル
2950	2-フルオロエチル	4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル) -フェニル
2951	2-フルオロエチル	3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル
2952	2-フルオロエチル	4-ブロモ-3-(トリフルオロメチル) -フェニル
2953	2-フルオロエチル	3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル
2954	2-フルオロエチル	2-ブロモ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル
2955	2-フルオロエチル	5-ブロモ-2-メトキシフェニル
2956	2-フルオロエチル	3-ブロモ-4-メトキシフェニル
2957	2-フルオロエチル	2-フルオロ-2-イソプロピルフェニル
2958	2-フルオロエチル	4-フルオロ-3-イソプロピルフェニル
2959	2-フルオロエチル	3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) -フェニル
2960	2-フルオロエチル	3-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) -フェニル
2961	2-フルオロエチル	3-アセチルフェニル
2962	2-フルオロエチル	3-アセチルアミノフェニル
2963	2-フルオロエチル	3-カルボキシフェニル
2964	2-フルオロエチル	3-シアノフェニル
2965	2-フルオロエチル	3-ニトロフェニル

10

20

30

40

2966	2-フルオロエチル	3-ヒドロキシフェニル
2967	2-フルオロエチル	3-(O-ベンジル) -フェニル
2968	2-フルオロエチル	3-(2-メトキシエトキシ) -フェニル
2969	2-フルオロエチル	3-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ) -フェニル
2970	2-フルオロエチル	3-(NH-CO-NH <sub>2</sub> ) -フェニル
2971	2-フルオロエチル	3-(メチルスルファニル) -フェニル
2972	2-フルオロエチル	3-(フルオロメチルスルファニル) -フェニル
2973	2-フルオロエチル	3-(ジフルオロメチルスルファニル) -フェニル
2974	2-フルオロエチル	3-(トリフルオロメチルスルファニル) -フェニル
2975	2-フルオロエチル	3-(メチルスルホニル) -フェニル
2976	2-フルオロエチル	3-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ) -フェニル
2977	2-フルオロエチル	3-(メトキシアミノ) -フェニル
2978	2-フルオロエチル	3-(エトキシアミノ) -フェニル
2979	2-フルオロエチル	3-(N-メチルアミノオキシ) -フェニル
2980	2-フルオロエチル	3-(N, N-ジメチルアミノオキシ) -フェニル
2981	2-フルオロエチル	3-(アゼチジン-1-イル) -フェニル
2982	2-フルオロエチル	3-(2-メチルアゼチジン-1-イル) -フェニル
2983	2-フルオロエチル	3-( (S) -2-メチルアゼチジン-1-イル) -フェニル
2984	2-フルオロエチル	3-( (R) -2-メチルアゼチジン-1-イル) -フェニル
2985	2-フルオロエチル	3-(3-フルオロアゼチジン-1-イル) -フェニル
2986	2-フルオロエチル	3-(2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル) -フェニル
2987	2-フルオロエチル	3-(2-メトキシアゼチジン-1-イル) -フェニル
2988	2-フルオロエチル	3-(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル) -フェニル
2989	2-フルオロエチル	3-(ピロリジン-1-イル) -フェニル
2990	2-フルオロエチル	3-(ピロリジン-2-イル) -フェニル
2991	2-フルオロエチル	3-( (S) -ピロリジン-2-イル) -フェニル
2992	2-フルオロエチル	3-( (R) -ピロリジン-2-イル) -フェニル
2993	2-フルオロエチル	3-(ピロリジン-3-イル) -フェニル
2994	2-フルオロエチル	3-( (S) -ピロリジン-3-イル) -フェニル
2995	2-フルオロエチル	3-( (R) -ピロリジン-3-イル) -フェニル

10

20

30

40

2996	2-フルオロエチル	3-(ピロリジン-1-イル) -5-(トリフルオロメチル) -フェニル	
2997	2-フルオロエチル	5-(ピロリジン-1-イル) -2-メトキシフェニル	
2998	2-フルオロエチル	3-(ピロリジン-1-イル) -2-メトキシフェニル	
2999	2-フルオロエチル	5-(ピロリジン-1-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル	
3000	2-フルオロエチル	3-(ピロリジン-1-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル	
3001	2-フルオロエチル	3-(2-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	10
3002	2-フルオロエチル	3-((S)-2-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
3003	2-フルオロエチル	3-((R)-2-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
3004	2-フルオロエチル	3-(3-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
3005	2-フルオロエチル	3-((S)-3-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	20
3006	2-フルオロエチル	3-((R)-3-フルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
3007	2-フルオロエチル	3-(2, 2-ジフルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
3008	2-フルオロエチル	3-(3, 3-ジフルオロピロリジン-1-イル) -フェニル	
3009	2-フルオロエチル	3-(2-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
3010	2-フルオロエチル	3-((S)-2-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
3011	2-フルオロエチル	3-((R)-2-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル	30
3012	2-フルオロエチル	3-(3-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
3013	2-フルオロエチル	3-((S)-3-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
3014	2-フルオロエチル	3-((R)-3-メチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
3015	2-フルオロエチル	3-(1-メチルピロリジン-2-イル) -フェニル	
3016	2-フルオロエチル	3-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル) -フェニル	
3017	2-フルオロエチル	3-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル) -フェニル	
3018	2-フルオロエチル	3-(1-メチルピロリジン-3-イル) -フェニル	40
3019	2-フルオロエチル	3-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル) -フェニル	
3020	2-フルオロエチル	3-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル) -フェニル	

3021	2-フルオロエチル	3-(2, 2-ジメチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
3022	2-フルオロエチル	3-(3, 3-ジメチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
3023	2-フルオロエチル	3-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
3024	2-フルオロエチル	3-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
3025	2-フルオロエチル	3-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル) -フェニル	10
3026	2-フルオロエチル	3-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
3027	2-フルオロエチル	3-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル) -フェニル	
3028	2-フルオロエチル	3-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル) -フェニル	20
3029	2-フルオロエチル	3-(2-オキソピロリジン-1-イル) -フェニル	
3030	2-フルオロエチル	3-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル) -フェニル	
3031	2-フルオロエチル	3-(ピペリジン-1-イル) -フェニル	
3032	2-フルオロエチル	3-(2-メチルピペリジン-1-イル) -フェニル	
3033	2-フルオロエチル	3-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル) -フェニル	
3034	2-フルオロエチル	3-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル) -フェニル	
3035	2-フルオロエチル	3-(2-フルオロピペリジン-1-イル) -フェニル	30
3036	2-フルオロエチル	3-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル) -フェニル	
3037	2-フルオロエチル	3-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル) -フェニル	
3038	2-フルオロエチル	3-(2, 2-ジフルオロピペリジン-1-イル) -フェニル	
3039	2-フルオロエチル	3-(ピペラジン-1-イル) -フェニル	
3040	2-フルオロエチル	3-(4-メチルピペラジン-1-イル) -フェニル	
3041	2-フルオロエチル	3-(モルホリン-4-イル) -フェニル	
3042	2-フルオロエチル	3-(モルホリン-4-イル) -5-(トリフルオロメチル) -フェニル	40
3043	2-フルオロエチル	5-(モルホリン-4-イル) -2-メトキシフェニル	

3044	2-フルオロエチル	3- (モルホリン-4-イル) -4-メトキシフェニル
3045	2-フルオロエチル	5- (モルホリン-4-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル
3046	2-フルオロエチル	3- (モルホリン-4-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル
3047	2-フルオロエチル	3- (チオモルホリン-4-イル) -フェニル
3048	2-フルオロエチル	3- (1-オキソチオモルホリン-4-イル) -フェニル
3049	2-フルオロエチル	3- (1, 1-ジオキソチオモルホリン-4-イル) -フェニル
3050	2-フルオロエチル	3- (ピロール-1-イル) -フェニル
3051	2-フルオロエチル	3- (ピロール-2-イル) -フェニル
3052	2-フルオロエチル	3- (ピロール-3-イル) -フェニル
3053	2-フルオロエチル	3- (1-メチルピロール-2-イル) -フェニル
3054	2-フルオロエチル	3- (1-メチルピロール-3-イル) -フェニル
3055	2-フルオロエチル	3- (フラン-2-イル) -フェニル
3056	2-フルオロエチル	3- (フラン-3-イル) -フェニル
3057	2-フルオロエチル	3- (チオフエン-2-イル) -フェニル
3058	2-フルオロエチル	3- (チオフエン-3-イル) -フェニル
3059	2-フルオロエチル	3- (5-プロピルチエン-2-イル) -フェニル
3060	2-フルオロエチル	3- (ピラゾール-1-イル) -フェニル
3061	2-フルオロエチル	3- (ピラゾール-3-イル) -フェニル
3062	2-フルオロエチル	3- (ピラゾール-4-イル) -フェニル
3063	2-フルオロエチル	3- (4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル
3064	2-フルオロエチル	3- (1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
3065	2-フルオロエチル	3- (1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
3066	2-フルオロエチル	3- (1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) -フェニル
3067	2-フルオロエチル	3- (1H-イミダゾール-2-イル) -フェニル
3068	2-フルオロエチル	3- (イミダゾール-1-イル) -フェニル
3069	2-フルオロエチル	3- (1-メチルイミダゾール-2-イル) -フェニル
3070	2-フルオロエチル	3- (オキサゾール-2-イル) -フェニル
3071	2-フルオロエチル	3- (オキサゾール-4-イル) -フェニル
3072	2-フルオロエチル	3- (オキサゾール-5-イル) -フェニル
3073	2-フルオロエチル	3- (イソオキサゾール-3-イル) -フェニル

10

20

30

40

3074	2-フルオロエチル	3-(イソオキサゾール-4-イル)-フェニル
3075	2-フルオロエチル	3-(イソオキサゾール-5-イル)-フェニル
3076	2-フルオロエチル	3-(チアゾール-2-イル)-フェニル
3077	2-フルオロエチル	3-(チアゾール-4-イル)-フェニル
3078	2-フルオロエチル	3-(チアゾール-5-イル)-フェニル
3079	2-フルオロエチル	3-(2-メチルチアゾール-4-イル)-フェニル
3080	2-フルオロエチル	3-(2-メチルチアゾール-5-イル)-フェニル
3081	2-フルオロエチル	3-([1, 2, 3]-トリアゾール-1-イル)-フェニル
3082	2-フルオロエチル	3-([1, 2, 4]-トリアゾール-1-イル)-フェニル
3083	2-フルオロエチル	3-([1, 2, 3]-トリアゾール-2-イル)-フェニル
3084	2-フルオロエチル	3-(4H-[1, 2, 4]-トリアゾール-3-イル)-フェニル
3085	2-フルオロエチル	3-([1, 2, 4]-トリアゾール-4-イル)-フェニル
3086	2-フルオロエチル	3-(2H-[1, 2, 3]-トリアゾール-4-イル)-フェニル
3087	2-フルオロエチル	3-(4-メチル-4H-[1, 2, 4]-トリアゾール-3-イル)-フェニル
3088	2-フルオロエチル	3-(2-メチル-2H-[1, 2, 3]-トリアゾール-4-イル)-フェニル
3089	2-フルオロエチル	3-([1, 3, 4]-オキサジアゾール-2-イル)-フェニル
3090	2-フルオロエチル	3-(5-メチル-[1, 3, 4]-オキサジアゾール-2-イル)-フェニル
3091	2-フルオロエチル	3-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル
3092	2-フルオロエチル	3-(5-メチル-[1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル
3093	2-フルオロエチル	3-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル

10

20

30

40

3094	2-フルオロエチル	3- ([1, 2, 3] -オキサジアゾール-4-イル) -フェニル	
3095	2-フルオロエチル	3- ([1, 2, 3] -オキサジアゾール-5-イル) -フェニル	
3096	2-フルオロエチル	3- ([1, 2, 3] -チアジアゾール-4-イル) -フェニル	
3097	2-フルオロエチル	3- (1H-テトラゾール-5-イル) -フェニル	10
3098	2-フルオロエチル	3- (テトラゾール-1-イル) -フェニル	
3099	2-フルオロエチル	3- (2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル) -フェニル	
3100	2-フルオロエチル	3- (1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル) -フェニル	
3101	2-フルオロエチル	3-フラザン-3-イル-フェニル	
3102	2-フルオロエチル	3- (ピリド-2-イル) -フェニル	20
3103	2-フルオロエチル	3- (ピリド-3-イル) -フェニル	
3104	2-フルオロエチル	3- (ピリド-4-イル) -フェニル	
3105	2-フルオロエチル	3- (ピリミジン-2-イル) -フェニル	
3106	2-フルオロエチル	3- (2-メチルピリミジン-4-イル) -フェニル	
3107	2-フルオロエチル	3- (ピリミジン-4-イル) -フェニル	
3108	2-フルオロエチル	3- (ピリミジン-5-イル) -フェニル	
3109	2-フルオロエチル	5-プロモピリジン-3-イル	30
3110	2-フルオロエチル	3-プロモ-2-クロロピリジン-5-イル	
3111	2-フルオロエチル	4-メチルピリジン-2-イル	
3112	2-フルオロエチル	6-メチルピリジン-2-イル	
3113	2-フルオロエチル	4- (トリフルオロメチル) -ピリジン-2-イル	
3114	2-フルオロエチル	6- (トリフルオロメチル) -ピリジン-2-イル	
3115	2-フルオロエチル	5- (トリフルオロメチル) -ピリジン-3-イル	
3116	2-フルオロエチル	5- (ピロリジン-1-イル) -ピリジン-3-イル	40
3117	2-フルオロエチル	3- (ピロリジン-1-イル) -2-クロロピリジン-5-イル	

3118	2-フルオロエチル	3-(モルホリン-4-イル)-2-クロロピリジン-5-イル
3119	2-フルオロエチル	2-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-5-イル
3120	2-フルオロエチル	2-フェノキシピリジン-5-イル
3121	2-フルオロエチル	4-メチルフェニル
3122	2-フルオロエチル	4-エチルフェニル
3123	2-フルオロエチル	4-プロピルフェニル
3124	2-フルオロエチル	4-イソプロピルフェニル
3125	2-フルオロエチル	4-sec-ブチルフェニル
3126	2-フルオロエチル	4-tert-ブチルフェニル
3127	2-フルオロエチル	4-イソブチルフェニル
3128	2-フルオロエチル	4-(1,1-ジメチルプロピル)フェニル
3129	2-フルオロエチル	4-ビニルフェニル
3130	2-フルオロエチル	4-イソプロペニルフェニル
3131	2-フルオロエチル	4-フルオロフェニル
3132	2-フルオロエチル	4-クロロフェニル
3133	2-フルオロエチル	4-ブロモフェニル
3134	2-フルオロエチル	4-ヨードフェニル
3135	2-フルオロエチル	4-(フルオロメチル)フェニル
3136	2-フルオロエチル	4-(ジフルオロメチル)フェニル
3137	2-フルオロエチル	4-(トリフルオロメチル)フェニル
3138	2-フルオロエチル	2,4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル
3139	2-フルオロエチル	4-(1-フルオロエチル)フェニル
3140	2-フルオロエチル	4-((S)-1-フルオロエチル)フェニル
3141	2-フルオロエチル	4-((R)-1-フルオロエチル)フェニル
3142	2-フルオロエチル	4-(2-フルオロエチル)フェニル
3143	2-フルオロエチル	4-(1,1-ジフルオロエチル)フェニル
3144	2-フルオロエチル	4-(2,2-ジフルオロエチル)フェニル
3145	2-フルオロエチル	4-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル
3146	2-フルオロエチル	4-(3-フルオロプロピル)フェニル
3147	2-フルオロエチル	4-(2-フルオロプロピル)フェニル

10

20

30

40

3148	2-フルオロエチル	4-((S)-2-フルオロプロピル)-フェニル	
3149	2-フルオロエチル	4-((R)-2-フルオロプロピル)-フェニル	
3150	2-フルオロエチル	4-(3,3-ジフルオロプロピル)-フェニル	
3151	2-フルオロエチル	4-(3,3,3-トリフルオロプロピル)-フェニル	
3152	2-フルオロエチル	4-(1-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3153	2-フルオロエチル	4-(2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3154	2-フルオロエチル	4-((S)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	10
3155	2-フルオロエチル	4-((R)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3156	2-フルオロエチル	4-(2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3157	2-フルオロエチル	4-((S)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3158	2-フルオロエチル	4-((R)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3159	2-フルオロエチル	4-(2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	20
3160	2-フルオロエチル	4-((S)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3161	2-フルオロエチル	4-((R)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3162	2-フルオロエチル	4-(2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル)-フェニル	
3163	2-フルオロエチル	4-(1-ジフルオロメチル-2,2-ジフルオロエチル)-フェニル	30
3164	2-フルオロエチル	4-(1,1-ジメチル-2-フルオロエチル)-フェニル	
3165	2-フルオロエチル	4-メトキシフェニル	
3166	2-フルオロエチル	4-エトキシフェニル	
3167	2-フルオロエチル	4-プロポキシフェニル	
3168	2-フルオロエチル	4-イソプロポキシフェニル	
3169	2-フルオロエチル	4-ブトキシフェニル	40
3170	2-フルオロエチル	4-(フルオロメトキシ)-フェニル	
3171	2-フルオロエチル	4-(ジフルオロメトキシ)-フェニル	

3172	2-フルオロエチル	4-(トリフルオロメトキシ)-フェニル
3173	2-フルオロエチル	4-(2-フルオロエトキシ)-フェニル
3174	2-フルオロエチル	4-(2, 2-ジフルオロエトキシ)-フェニル
3175	2-フルオロエチル	4-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)-フェニル
3176	2-フルオロエチル	4-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)-フェニル
3177	2-フルオロエチル	4-シクロプロピルフェニル
3178	2-フルオロエチル	4-シクロブチルフェニル
3179	2-フルオロエチル	4-シクロペンチルフェニル
3180	2-フルオロエチル	4-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル)-フェニル
3181	2-フルオロエチル	3, 4-ジフルオロフェニル
3182	2-フルオロエチル	4-プロモ-2-フルオロフェニル
3183	2-フルオロエチル	2-プロモ-4-フルオロフェニル
3184	2-フルオロエチル	4-プロモ-2, 5-ジフルオロフェニル
3185	2-フルオロエチル	5-プロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
3186	2-フルオロエチル	3-プロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
3187	2-フルオロエチル	3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)-フェニル
3188	2-フルオロエチル	4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)-フェニル
3189	2-フルオロエチル	3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)-フェニル
3190	2-フルオロエチル	3-プロモ-4-(トリフルオロメチル)-フェニル
3191	2-フルオロエチル	5-プロモ-3-(トリフルオロメチル)-フェニル
3192	2-フルオロエチル	5-プロモ-2-(トリフルオロメチル)-フェニル
3193	2-フルオロエチル	2-プロモ-5-メトキシフェニル
3194	2-フルオロエチル	4-プロモ-3-メトキシフェニル
3195	2-フルオロエチル	3-フルオロ-2-イソプロピルフェニル
3196	2-フルオロエチル	3-フルオロ-4-イソプロピルフェニル
3197	2-フルオロエチル	4-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)-フェニル
3198	2-フルオロエチル	4-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-フェニル
3199	2-フルオロエチル	4-アセチルフェニル
3200	2-フルオロエチル	4-アセチルアミノフェニル
3201	2-フルオロエチル	4-カルボキシフェニル

10

20

30

40

3202	2-フルオロエチル	4-シアノフェニル
3203	2-フルオロエチル	4-ニトロフェニル
3204	2-フルオロエチル	4-ヒドロキシフェニル
3205	2-フルオロエチル	4-(O-ベンジル) -フェニル
3206	2-フルオロエチル	4-(2-メトキシエトキシ) -フェニル
3207	2-フルオロエチル	4-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ) -フェニル
3208	2-フルオロエチル	4-(NH-CO-NH <sub>2</sub> ) -フェニル
3209	2-フルオロエチル	4-(メチルスルファニル) -フェニル
3210	2-フルオロエチル	4-(フルオロメチルスルファニル) -フェニル
3211	2-フルオロエチル	4-(ジフルオロメチルスルファニル) -フェニル
3212	2-フルオロエチル	4-(トリフルオロメチルスルファニル) -フェニル
3213	2-フルオロエチル	4-(メチルスルホニル) -フェニル
3214	2-フルオロエチル	4-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ) -フェニル
3215	2-フルオロエチル	4-(メトシアミノ) -フェニル
3216	2-フルオロエチル	4-(エトシアミノ) -フェニル
3217	2-フルオロエチル	4-(N-メチルアミノオキシ) -フェニル
3218	2-フルオロエチル	4-(N, N-ジメチルアミノオキシ) -フェニル
3219	2-フルオロエチル	4-(アゼチジン-1-イル) -フェニル
3220	2-フルオロエチル	4-(2-メチルアゼチジン-1-イル) -フェニル
3221	2-フルオロエチル	4-( (S) -2-メチルアゼチジン-1-イル) -フェニル
3222	2-フルオロエチル	4-( (R) -2-メチルアゼチジン-1-イル) -フェニル
3223	2-フルオロエチル	4-(3-フルオロアゼチジン-1-イル) -フェニル
3224	2-フルオロエチル	4-(2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル) -フェニル
3225	2-フルオロエチル	4-(2-メトシアゼチジン-1-イル) -フェニル
3226	2-フルオロエチル	4-(3-ヒドロシアゼチジン-1-イル) -フェニル
3227	2-フルオロエチル	4-(ピロリジン-1-イル) -フェニル
3228	2-フルオロエチル	4-(ピロリジン-2-イル) -フェニル
3229	2-フルオロエチル	4-( (S) -ピロリジン-2-イル) -フェニル
3230	2-フルオロエチル	3-( (R) -ピロリジン-2-イル) -フェニル
3231	2-フルオロエチル	4-(ピロリジン-3-イル) -フェニル

10

20

30

40

3 2 3 2	2-フルオロエチル	4-((S)-ピロリジン-3-イル)-フェニル
3 2 3 3	2-フルオロエチル	4-((R)-ピロリジン-3-イル)-フェニル
3 2 3 4	2-フルオロエチル	4-(ピロリジン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)- フェニル
3 2 3 5	2-フルオロエチル	4-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル
3 2 3 6	2-フルオロエチル	4-(ピロリジン-1-イル)-3,4-メトキシフェニル
3 2 3 7	2-フルオロエチル	4-(ピロリジン-1-イル)-2,5-ジフルオロフェニル
3 2 3 8	2-フルオロエチル	4-(ピロリジン-1-イル)-2,6-ジフルオロフェニル
3 2 3 9	2-フルオロエチル	4-(2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
3 2 4 0	2-フルオロエチル	4-((S)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
3 2 4 1	2-フルオロエチル	4-((R)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
3 2 4 2	2-フルオロエチル	4-(3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
3 2 4 3	2-フルオロエチル	4-((S)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
3 2 4 4	2-フルオロエチル	4-((R)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
3 2 4 5	2-フルオロエチル	4-(2,2-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
3 2 4 6	2-フルオロエチル	4-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル
3 2 4 7	2-フルオロエチル	4-(2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル
3 2 4 8	2-フルオロエチル	4-((S)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル
3 2 4 9	2-フルオロエチル	4-((R)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル
3 2 5 0	2-フルオロエチル	4-(3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル
3 2 5 1	2-フルオロエチル	4-((S)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル
3 2 5 2	2-フルオロエチル	4-((R)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル
3 2 5 3	2-フルオロエチル	4-(1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル
3 2 5 4	2-フルオロエチル	4-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル
3 2 5 5	2-フルオロエチル	4-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル
3 2 5 6	2-フルオロエチル	4-(1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル

10

20

30

40

3257	2-フルオロエチル	4-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
3258	2-フルオロエチル	4-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
3259	2-フルオロエチル	4-(2,2-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3260	2-フルオロエチル	4-(3,3-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3261	2-フルオロエチル	4-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3262	2-フルオロエチル	4-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	10
3263	2-フルオロエチル	4-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3264	2-フルオロエチル	4-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3265	2-フルオロエチル	4-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	20
3266	2-フルオロエチル	4-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3267	2-フルオロエチル	4-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル	
3268	2-フルオロエチル	4-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル	
3269	2-フルオロエチル	4-(ピペリジン-1-イル)-フェニル	
3270	2-フルオロエチル	4-(2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
3271	2-フルオロエチル	4-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	30
3272	2-フルオロエチル	4-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
3273	2-フルオロエチル	4-(2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
3274	2-フルオロエチル	4-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
3275	2-フルオロエチル	4-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
3276	2-フルオロエチル	4-(2,2-ジフルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
3277	2-フルオロエチル	4-(ピペラジン-1-イル)-フェニル	
3278	2-フルオロエチル	4-(4-メチルピペラジン-1-イル)-フェニル	40
3279	2-フルオロエチル	4-(モルホリン-4-イル)-フェニル	

3280	2-フルオロエチル	4-(モルホリン-4-イル) -5-(トリフルオロメチル)-フェニル	
3281	2-フルオロエチル	4-(モルホリン-4-イル) -2-メトキシフェニル	
3282	2-フルオロエチル	4-(モルホリン-4-イル) -3-メトキシフェニル	
3283	2-フルオロエチル	4-(モルホリン-4-イル) -2, 5-ジフルオロフェニル	
3284	2-フルオロエチル	4-(モルホリン-4-イル) -2, 6-ジフルオロフェニル	
3285	2-フルオロエチル	4-(チオモルホリン-4-イル) -フェニル	10
3286	2-フルオロエチル	4-(1-オキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル	
3287	2-フルオロエチル	4-(1, 1-ジオキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル	
3288	2-フルオロエチル	4-(ピロール-1-イル) -フェニル	
3289	2-フルオロエチル	4-(ピロール-2-イル) -フェニル	
3290	2-フルオロエチル	4-(ピロール-3-イル) -フェニル	
3291	2-フルオロエチル	4-(1-メチルピロール-2-イル) -フェニル	20
3292	2-フルオロエチル	4-(1-メチルピロール-3-イル) -フェニル	
3293	2-フルオロエチル	4-(フラン-2-イル) -フェニル	
3294	2-フルオロエチル	4-(フラン-3-イル) -フェニル	
3295	2-フルオロエチル	4-(チオフエン-2-イル) -フェニル	
3296	2-フルオロエチル	4-(チオフエン-3-イル) -フェニル	
3297	2-フルオロエチル	4-(5-プロピルチエン-2-イル) -フェニル	
3298	2-フルオロエチル	4-(ピラゾール-1-イル) -フェニル	
3299	2-フルオロエチル	4-(ピラゾール-3-イル) -フェニル	30
3300	2-フルオロエチル	4-(ピラゾール-4-イル) -フェニル	
3301	2-フルオロエチル	4-(4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル	
3302	2-フルオロエチル	4-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル	
3303	2-フルオロエチル	4-(1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル	
3304	2-フルオロエチル	4-(1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) -フェニル	
3305	2-フルオロエチル	4-(1H-イミダゾール-2-イル) -フェニル	
3306	2-フルオロエチル	4-(イミダゾール-1-イル) -フェニル	40
3307	2-フルオロエチル	4-(1-メチルイミダゾール-2-イル) -フェニル	

3308	2-フルオロエチル	4- (オキサゾール-2-イル) -フェニル
3309	2-フルオロエチル	4- (オキサゾール-4-イル) -フェニル
3310	2-フルオロエチル	4- (オキサゾール-5-イル) -フェニル
3311	2-フルオロエチル	4- (イソオキサゾール-3-イル) -フェニル
3312	2-フルオロエチル	4- (イソオキサゾール-4-イル) -フェニル
3313	2-フルオロエチル	3- (イソオキサゾール-5-イル) -フェニル
3314	2-フルオロエチル	4- (チアゾール-2-イル) -フェニル
3315	2-フルオロエチル	4- (チアゾール-4-イル) -フェニル
3316	2-フルオロエチル	4- (チアゾール-5-イル) -フェニル
3317	2-フルオロエチル	4- (2-メチルチアゾール-4-イル) -フェニル
3318	2-フルオロエチル	4- (4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル
3319	2-フルオロエチル	4- ([1, 2, 3] -トリアゾール-1-イル) -フェニル
3320	2-フルオロエチル	4- ([1, 2, 4] -トリアゾール-1-イル) -フェニル
3321	2-フルオロエチル	4- ([1, 2, 3] -トリアゾール-2-イル) -フェニル
3322	2-フルオロエチル	4- (4H-[1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル
3323	2-フルオロエチル	4- ([1, 2, 4] -トリアゾール-4-イル) -フェニル
3324	2-フルオロエチル	4- (2H-[1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル
3325	2-フルオロエチル	4- (4-メチル-4H-[1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル
3326	2-フルオロエチル	4- (2-メチル-2H-[1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル
3327	2-フルオロエチル	4- ([1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル
3328	2-フルオロエチル	4- (5-メチル-[1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル
3329	2-フルオロエチル	4- ([1, 2, 4] -オキサジアゾール-3-イル) -フェニル

10

20

30

40

3330	2-フルオロエチル	4-(5-メチル-[1,2,4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
3331	2-フルオロエチル	4-([1,2,4]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	
3332	2-フルオロエチル	4-([1,2,3]-オキサジアゾール-4-イル)-フェニル	
3333	2-フルオロエチル	4-([1,2,3]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	10
3334	2-フルオロエチル	4-([1,2,3]-チアジアゾール-4-イル)-フェニル	
3335	2-フルオロエチル	4-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
3336	2-フルオロエチル	4-(テトラゾール-1-イル)-フェニル	
3337	2-フルオロエチル	4-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	20
3338	2-フルオロエチル	4-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
3339	2-フルオロエチル	4-フラザン-3-イル-フェニル	
3340	2-フルオロエチル	4-(ピリド-2-イル)-フェニル	
3341	2-フルオロエチル	4-(ピリド-3-イル)-フェニル	
3342	2-フルオロエチル	4-(ピリド-4-イル)-フェニル	
3343	2-フルオロエチル	4-(ピリミジン-2-イル)-フェニル	30
3344	2-フルオロエチル	4-(2-メチルピリミジン-4-イル)-フェニル	
3345	2-フルオロエチル	4-(ピリミジン-4-イル)-フェニル	
3346	2-フルオロエチル	4-(ピリミジン-5-イル)-フェニル	
3347	2-フルオロエチル	4-プロモ-2-クロロピリジン-5-イル	
3348	2-フルオロエチル	4-メチルピリジン-2-イル	
3349	2-フルオロエチル	5-メチルピリジン-2-イル	
3350	2-フルオロエチル	4-(ピロリジン-1-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	40
3351	2-フルオロエチル	4-(モルホリン-4-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	

3352	2-フルオロエチル	2-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-5-イル	
3353	2-フルオロエチル	5-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-2-イル	
3354	2-フルオロエチル	2-フェノキシピリジン-5-イル	
3355	2-フルオロエチル	2,3-ジクロロフェニル	
3356	2-フルオロエチル	2,5-ジクロロフェニル	
3357	2-フルオロエチル	3,5-ジクロロフェニル	
3358	2-フルオロエチル	3-クロロ-4-フルオロフェニル	10
3359	2-フルオロエチル	4-ブロモ-2,5-ジクロロフェニル	
3360	2-フルオロエチル	3-ブロモ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル	
3361	2-フルオロエチル	3,5-ジブロモ-4-(2-フルオロエトキシ)フェニル	
3362	2-フルオロエチル	2,5-ジメチルフェニル	
3363	2-フルオロエチル	2,5-ジ-(トリフルオロメチル)フェニル	
3364	2-フルオロエチル	3,5-ジ-(トリフルオロメチル)フェニル	
3365	2-フルオロエチル	2,5-ジメトキシフェニル	20
3366	2-フルオロエチル	2-メトキシ-5-メチルフェニル	
3367	2-フルオロエチル	2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル	
3368	2-フルオロエチル	4-フルオロ-3-(オキサゾール-4-イル)フェニル	
3369	2-フルオロエチル	チエン-2-イル	
3370	2-フルオロエチル	チエン-3-イル	
3371	2-フルオロエチル	3-クロロチエン-2-イル	
3372	2-フルオロエチル	4-クロロチエン-2-イル	30
3373	2-フルオロエチル	5-クロロチエン-2-イル	
3374	2-フルオロエチル	3-ブロモチエン-2-イル	
3375	2-フルオロエチル	4-ブロモチエン-2-イル	
3376	2-フルオロエチル	5-ブロモチエン-2-イル	
3377	2-フルオロエチル	4,5-ジクロロチエン-2-イル	
3378	2-フルオロエチル	4,5-ジブロモチエン-2-イル	
3379	2-フルオロエチル	4-ブロモ-5-クロロチエン-2-イル	40
3380	2-フルオロエチル	3-ブロモ-5-クロロチエン-2-イル	
3381	2-フルオロエチル	5-メチルチエン-2-イル	

3382	2-フルオロエチル	5-エチルチエン-2-イル
3383	2-フルオロエチル	5-プロピルチエン-2-イル
3384	2-フルオロエチル	5-トリフルオロメチルチエン-2-イル
3385	2-フルオロエチル	5-フェニルチエン-2-イル
3386	2-フルオロエチル	5-(ピリド-2-イル)-チエン-2-イル
3387	2-フルオロエチル	5-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル
3388	2-フルオロエチル	4-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル
3389	2-フルオロエチル	5-(ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル
3390	2-フルオロエチル	5-(3-クロロ-5-トリフルオロ-ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル
3391	2-フルオロエチル	5-(ベンゾイルアミノメチル)-チエン-2-イル
3392	2-フルオロエチル	5-((4-クロロベンゾイル)アミノメチル)-チエン-2-イル
3393	2-フルオロエチル	5-(アセチルアミノメチル)-チエン-2-イル
3394	2-フルオロエチル	5-(ピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル
3395	2-フルオロエチル	5-(ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
3396	2-フルオロエチル	5-(ピラゾール-4-イル)-チエン-2-イル
3397	2-フルオロエチル	5-(ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル
3398	2-フルオロエチル	5-(4-フルオロピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル
3399	2-フルオロエチル	5-(1-メチル-5-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
3400	2-フルオロエチル	5-(1-メチル-3-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル
3401	2-フルオロエチル	5-(4-カルボキシ-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
3402	2-フルオロエチル	5-(4-アミノメチル-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
3403	2-フルオロエチル	5-(イソキサゾール-3-イル)-チエン-2-イル
3404	2-フルオロエチル	5-(イソキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
3405	2-フルオロエチル	5-(イソキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル

10

20

30

40

3406	2-フルオロエチル	5- (5-トリフルオロメチルイソキサゾール-3-イル) - チエン-2-イル
3407	2-フルオロエチル	5- (オキサゾール-2-イル) -チエン-2-イル
3408	2-フルオロエチル	5- (オキサゾール-4-イル) -チエン-2-イル
3409	2-フルオロエチル	5- (オキサゾール-5-イル) -チエン-2-イル
3410	2-フルオロエチル	5- (2-メチルオキサゾール-4-イル) -チエン-2-イル
3411	2-フルオロエチル	5- (2-メチルオキサゾール-5-イル) -チエン-2-イル
3412	2-フルオロエチル	5- (イソチアゾール-3-イル) -チエン-2-イル
3413	2-フルオロエチル	5- (イソチアゾール-4-イル) -チエン-2-イル
3414	2-フルオロエチル	5- (イソチアゾール-5-イル) -チエン-2-イル
3415	2-フルオロエチル	5- (5-トリフルオロメチルイソチアゾール-3-イル) -チ エン-2-イル
3416	2-フルオロエチル	5- (チアゾール-2-イル) -チエン-2-イル
3417	2-フルオロエチル	5- (チアゾール-4-イル) -チエン-2-イル
3418	2-フルオロエチル	5- (チアゾール-5-イル) -チエン-2-イル
3419	2-フルオロエチル	5- (2-メチルチアゾール-4-イル) -チエン-2-イル
3420	2-フルオロエチル	5- (2-メチルチアゾール-5-イル) -チエン-2-イル
3421	2-フルオロエチル	5- ([1, 2, 3] -オキサジアゾール-4-イル) -チエン -2-イル
3422	2-フルオロエチル	5- ([1, 2, 3] -チアジアゾール-4-イル) -チエン- 2-イル
3423	2-フルオロエチル	5- (ピリミジン-2-イル) -チエン-2-イル
3424	2-フルオロエチル	5- (ピリミジン-4-イル) -チエン-2-イル
3425	2-フルオロエチル	5- (ピリミジン-5-イル) -チエン-2-イル
3426	2-フルオロエチル	5- (2-メチルチオピリミジン-4-イル) -チエン-2-イ ル
3427	2-フルオロエチル	5- ([1, 3] -ジオキサラン-2-イル) -チエン-2-イ ル
3428	2-フルオロエチル	5- ([1, 3] -ジオキサラン-2-イル) -チエン-2-イ ルチエン-2-イル

10

20

30

40

3429	2-フルオロエチル	5-(3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル)-メチル)-チエン-2-イル
3430	2-フルオロエチル	5-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-ピリド-2-イルスルホニル]-チエン-2-イル
3431	2-フルオロエチル	2-クロロチエン-3-イル
3432	2-フルオロエチル	4-クロロチエン-3-イル
3433	2-フルオロエチル	5-クロロチエン-3-イル
3434	2-フルオロエチル	2-プロモチエン-3-イル
3435	2-フルオロエチル	4-プロモチエン-3-イル
3436	2-フルオロエチル	5-プロモチエン-3-イル
3437	2-フルオロエチル	2, 5-ジクロロチエン-3-イル
3438	2-フルオロエチル	2, 5-ジプロモチエン-3-イル
3439	2-フルオロエチル	2, 4, 5-トリクロロチエン-3-イル
3440	2-フルオロエチル	4-プロモ-2, 5-ジクロロチエン-3-イル
3441	2-フルオロエチル	2-クロロ-5-メチルスルホニルチエン-3-イル
3442	2-フルオロエチル	2, 5-ジメチルチエン-3-イル
3443	2-フルオロエチル	4-ヒドロキシチエン-3-イル
3444	2-フルオロエチル	2-フェニルチエン-3-イル
3445	2-フルオロエチル	4-フェニル-5-(トリフルオロメチル)-チエン-3-イル
3446	2-フルオロエチル	2-メトキシカルボニル-4-フェニル-5-(トリフルオロメチル)-チエン-3-イル
3447	2-フルオロエチル	ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
3448	2-フルオロエチル	ベンゾ [b] チオフェン-3-イル
3449	2-フルオロエチル	3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
3450	2-フルオロエチル	5-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
3451	2-フルオロエチル	5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
3452	2-フルオロエチル	5-クロロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
3453	2-フルオロエチル	5-プロモ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル
3454	シクロプロピルメチル	3-メチルフェニル
3455	シクロプロピルメチル	3-エチルフェニル

10

20

30

40

3456	シクロプロピルメチル	3-プロピルフェニル
3457	シクロプロピルメチル	3-イソプロピルフェニル
3458	シクロプロピルメチル	3-sec-ブチルフェニル
3459	シクロプロピルメチル	3-tert-ブチルフェニル
3460	シクロプロピルメチル	3-イソブチルフェニル
3461	シクロプロピルメチル	3-(1,1-ジメチルプロピル)-フェニル
3462	シクロプロピルメチル	3-ビニルフェニル
3463	シクロプロピルメチル	3-イソプロペニルフェニル
3464	シクロプロピルメチル	3-フルオロフェニル
3465	シクロプロピルメチル	2-フルオロフェニル
3466	シクロプロピルメチル	3-クロロフェニル
3467	シクロプロピルメチル	3-ブロモフェニル
3468	シクロプロピルメチル	3-ヨードフェニル
3469	シクロプロピルメチル	3-(フルオロメチル)フェニル
3470	シクロプロピルメチル	3-(ジフルオロメチル)フェニル
3471	シクロプロピルメチル	3-(トリフルオロメチル)フェニル
3472	シクロプロピルメチル	3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル
3473	シクロプロピルメチル	3-(1-フルオロエチル)-フェニル
3474	シクロプロピルメチル	3-(S)-1-フルオロエチル)-フェニル
3475	シクロプロピルメチル	3-(R)-1-フルオロエチル)-フェニル
3476	シクロプロピルメチル	3-(2-フルオロエチル)-フェニル
3477	シクロプロピルメチル	3-(1,1-ジフルオロエチル)-フェニル
3478	シクロプロピルメチル	3-(2,2-ジフルオロエチル)-フェニル
3479	シクロプロピルメチル	3-(2,2,2-トリフルオロエチル)-フェニル
3480	シクロプロピルメチル	3-(3-フルオロプロピル)-フェニル
3481	シクロプロピルメチル	3-(2-フルオロプロピル)-フェニル
3482	シクロプロピルメチル	3-(S)-2-フルオロプロピル)-フェニル
3483	シクロプロピルメチル	3-(R)-2-フルオロプロピル)-フェニル
3484	シクロプロピルメチル	3-(3,3-ジフルオロプロピル)-フェニル
3485	シクロプロピルメチル	3-(3,3,3-トリフルオロプロピル)-フェニル

10

20

30

40

3486	シクロプロピルメチル	3-(1-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3487	シクロプロピルメチル	3-(2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3488	シクロプロピルメチル	3-((S)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3489	シクロプロピルメチル	3-((R)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3490	シクロプロピルメチル	3-(2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3491	シクロプロピルメチル	3-((S)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	10
3492	シクロプロピルメチル	3-((R)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3493	シクロプロピルメチル	3-(2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3494	シクロプロピルメチル	3-((S)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	
3495	シクロプロピルメチル	3-((R)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル	20
3496	シクロプロピルメチル	3-(2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル)-フェニル	
3497	シクロプロピルメチル	3-(1-ジフルオロメチル-2,2-ジフルオロエチル)-フェニル	
3498	シクロプロピルメチル	3-(1,1-ジメチル-2-フルオロエチル)-フェニル	
3499	シクロプロピルメチル	3-メトキシフェニル	
3500	シクロプロピルメチル	3-エトキシフェニル	30
3501	シクロプロピルメチル	3-プロポキシフェニル	
3502	シクロプロピルメチル	3-イソプロポキシフェニル	
3503	シクロプロピルメチル	3-ブトキシフェニル	
3504	シクロプロピルメチル	3-(フルオロメトキシ)-フェニル	
3505	シクロプロピルメチル	3-(ジフルオロメトキシ)-フェニル	
3506	シクロプロピルメチル	3-(トリフルオロメトキシ)-フェニル	
3507	シクロプロピルメチル	3-(2-フルオロエトキシ)-フェニル	40
3508	シクロプロピルメチル	3-(2,2-ジフルオロエトキシ)-フェニル	
3509	シクロプロピルメチル	3-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-フェニル	

3510	シクロプロピルメチル	3-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ)フェニル
3511	シクロプロピルメチル	3-シクロプロピルフェニル
3512	シクロプロピルメチル	3-シクロブチルフェニル
3513	シクロプロピルメチル	3-シクロペンチルフェニル
3514	シクロプロピルメチル	3-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル)フェニル
3515	シクロプロピルメチル	3, 4-ジフルオロフェニル
3516	シクロプロピルメチル	3-プロモ-2-フルオロフェニル
3517	シクロプロピルメチル	2-プロモ-3-フルオロフェニル
3518	シクロプロピルメチル	3-プロモ-2, 5-ジフルオロフェニル
3519	シクロプロピルメチル	5-プロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
3520	シクロプロピルメチル	3-プロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
3521	シクロプロピルメチル	4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル
3522	シクロプロピルメチル	2-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
3523	シクロプロピルメチル	2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
3524	シクロプロピルメチル	4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル
3525	シクロプロピルメチル	3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
3526	シクロプロピルメチル	4-プロモ-3-(トリフルオロメチル)フェニル
3527	シクロプロピルメチル	3-プロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
3528	シクロプロピルメチル	2-プロモ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
3529	シクロプロピルメチル	5-プロモ-2-メトキシフェニル
3530	シクロプロピルメチル	3-プロモ-4-メトキシフェニル
3531	シクロプロピルメチル	2-フルオロ-2-イソプロピルフェニル
3532	シクロプロピルメチル	4-フルオロ-3-イソプロピルフェニル
3533	シクロプロピルメチル	3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル
3534	シクロプロピルメチル	3-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)フェニル
3535	シクロプロピルメチル	3-アセチルフェニル
3536	シクロプロピルメチル	3-アセチルアミノフェニル
3537	シクロプロピルメチル	3-カルボキシフェニル
3538	シクロプロピルメチル	3-シアノフェニル
3539	シクロプロピルメチル	3-ニトロフェニル

10

20

30

40

3540	シクロプロピルメチル	3-ヒドロキシフェニル
3541	シクロプロピルメチル	3-(O-ベンジル)フェニル
3542	シクロプロピルメチル	3-(2-メトキシエトキシ)フェニル
3543	シクロプロピルメチル	3-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )フェニル
3544	シクロプロピルメチル	3-(NH-CO-NH <sub>2</sub> )フェニル
3545	シクロプロピルメチル	3-(メチルスルファニル)フェニル
3546	シクロプロピルメチル	3-(フルオロメチルスルファニル)フェニル
3547	シクロプロピルメチル	3-(ジフルオロメチルスルファニル)フェニル
3548	シクロプロピルメチル	3-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル
3549	シクロプロピルメチル	3-(メチルスルホニル)フェニル
3550	シクロプロピルメチル	3-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ)フェニル
3551	シクロプロピルメチル	3-(メトキシアミノ)フェニル
3552	シクロプロピルメチル	3-(エトキシアミノ)フェニル
3553	シクロプロピルメチル	3-(N-メチルアミノオキシ)フェニル
3554	シクロプロピルメチル	3-(N, N-ジメチルアミノオキシ)フェニル
3555	シクロプロピルメチル	3-(アゼチジン-1-イル)フェニル
3556	シクロプロピルメチル	3-(2-メチルアゼチジン-1-イル)フェニル
3557	シクロプロピルメチル	3-( (S) -2-メチルアゼチジン-1-イル)フェニル
3558	シクロプロピルメチル	3-( (R) -2-メチルアゼチジン-1-イル)フェニル
3559	シクロプロピルメチル	3-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)フェニル
3560	シクロプロピルメチル	3-(2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル)フェニル
3561	シクロプロピルメチル	3-(2-メトキシアゼチジン-1-イル)フェニル
3562	シクロプロピルメチル	3-(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル)フェニル
3563	シクロプロピルメチル	3-(ピロリジン-1-イル)フェニル
3564	シクロプロピルメチル	3-(ピロリジン-2-イル)フェニル
3565	シクロプロピルメチル	3-( (S) -ピロリジン-2-イル)フェニル
3566	シクロプロピルメチル	3-( (R) -ピロリジン-2-イル)フェニル
3567	シクロプロピルメチル	3-(ピロリジン-3-イル)フェニル
3568	シクロプロピルメチル	3-( (S) -ピロリジン-3-イル)フェニル
3569	シクロプロピルメチル	3-( (R) -ピロリジン-3-イル)フェニル

10

20

30

40

3570	シクロプロピルメチル	3-(ピロリジン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-フェニル	
3571	シクロプロピルメチル	5-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル	
3572	シクロプロピルメチル	3-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル	
3573	シクロプロピルメチル	5-(ピロリジン-1-イル)-2,4-ジフルオロフェニル	
3574	シクロプロピルメチル	3-(ピロリジン-1-イル)-2,4-ジフルオロフェニル	
3575	シクロプロピルメチル	3-(2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	10
3576	シクロプロピルメチル	3-((S)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
3577	シクロプロピルメチル	3-((R)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
3578	シクロプロピルメチル	3-(3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
3579	シクロプロピルメチル	3-((S)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	20
3580	シクロプロピルメチル	3-((R)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
3581	シクロプロピルメチル	3-(2,2-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
3582	シクロプロピルメチル	3-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
3583	シクロプロピルメチル	3-(2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3584	シクロプロピルメチル	3-((S)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3585	シクロプロピルメチル	3-((R)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	30
3586	シクロプロピルメチル	3-(3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3587	シクロプロピルメチル	3-((S)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3588	シクロプロピルメチル	3-((R)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3589	シクロプロピルメチル	3-(1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
3590	シクロプロピルメチル	3-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
3591	シクロプロピルメチル	3-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
3592	シクロプロピルメチル	3-(1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	40
3593	シクロプロピルメチル	3-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
3594	シクロプロピルメチル	3-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	

3595	シクロプロピルメチル	3-(2,2-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3596	シクロプロピルメチル	3-(3,3-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3597	シクロプロピルメチル	3-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3598	シクロプロピルメチル	3-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3599	シクロプロピルメチル	3-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	10
3600	シクロプロピルメチル	3-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3601	シクロプロピルメチル	3-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3602	シクロプロピルメチル	3-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	20
3603	シクロプロピルメチル	3-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル	
3604	シクロプロピルメチル	3-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル	
3605	シクロプロピルメチル	3-(ピペリジン-1-イル)-フェニル	
3606	シクロプロピルメチル	3-(2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
3607	シクロプロピルメチル	3-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
3608	シクロプロピルメチル	3-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
3609	シクロプロピルメチル	3-(2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	30
3610	シクロプロピルメチル	3-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
3611	シクロプロピルメチル	3-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
3612	シクロプロピルメチル	3-(2,2-ジフルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
3613	シクロプロピルメチル	3-(ピペラジン-1-イル)-フェニル	
3614	シクロプロピルメチル	3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-フェニル	
3615	シクロプロピルメチル	3-(モルホリン-4-イル)-フェニル	
3616	シクロプロピルメチル	3-(モルホリン-4-イル)-5-(トリフルオロメチル)-フェニル	40
3617	シクロプロピルメチル	5-(モルホリン-4-イル)-2-メトキシフェニル	

3618	シクロプロピルメチル	3- (モルホリン-4-イル) -4-メトキシフェニル
3619	シクロプロピルメチル	5- (モルホリン-4-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル
3620	シクロプロピルメチル	3- (モルホリン-4-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル
3621	シクロプロピルメチル	3- (チオモルホリン-4-イル) -フェニル
3622	シクロプロピルメチル	3- (1-オキソチオモルホリン-4-イル) -フェニル
3623	シクロプロピルメチル	3- (1, 1-ジオキソチオモルホリン-4-イル) -フェニル
3624	シクロプロピルメチル	3- (ピロール-1-イル) -フェニル
3625	シクロプロピルメチル	3- (ピロール-2-イル) -フェニル
3626	シクロプロピルメチル	3- (ピロール-3-イル) -フェニル
3627	シクロプロピルメチル	3- (1-メチルピロール-2-イル) -フェニル
3628	シクロプロピルメチル	3- (1-メチルピロール-3-イル) -フェニル
3629	シクロプロピルメチル	3- (フラン-2-イル) -フェニル
3630	シクロプロピルメチル	3- (フラン-3-イル) -フェニル
3631	シクロプロピルメチル	3- (チオフエン-2-イル) -フェニル
3632	シクロプロピルメチル	3- (チオフエン-3-イル) -フェニル
3633	シクロプロピルメチル	3- (5-プロピルチエン-2-イル) -フェニル
3634	シクロプロピルメチル	3- (ピラゾール-1-イル) -フェニル
3635	シクロプロピルメチル	3- (ピラゾール-3-イル) -フェニル
3636	シクロプロピルメチル	3- (ピラゾール-4-イル) -フェニル
3637	シクロプロピルメチル	3- (4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル
3638	シクロプロピルメチル	3- (1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
3639	シクロプロピルメチル	3- (1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
3640	シクロプロピルメチル	3- (1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) -フェニル
3641	シクロプロピルメチル	3- (1H-イミダゾール-2-イル) -フェニル
3642	シクロプロピルメチル	3- (イミダゾール-1-イル) -フェニル
3643	シクロプロピルメチル	3- (1-メチルイミダゾール-2-イル) -フェニル
3644	シクロプロピルメチル	3- (オキサゾール-2-イル) -フェニル
3645	シクロプロピルメチル	3- (オキサゾール-4-イル) -フェニル
3646	シクロプロピルメチル	3- (オキサゾール-5-イル) -フェニル
3647	シクロプロピルメチル	3- (イソオキサゾール-3-イル) -フェニル

10

20

30

40

3648	シクロプロピルメチル	3- (イソオキサゾール-4-イル) -フェニル	
3649	シクロプロピルメチル	3- (イソオキサゾール-5-イル) -フェニル	
3650	シクロプロピルメチル	3- (チアゾール-2-イル) -フェニル	
3651	シクロプロピルメチル	3- (チアゾール-4-イル) -フェニル	
3652	シクロプロピルメチル	3- (チアゾール-5-イル) -フェニル	
3653	シクロプロピルメチル	3- (2-メチルチアゾール-4-イル) -フェニル	
3654	シクロプロピルメチル	3- (2-メチルチアゾール-5-イル) -フェニル	10
3655	シクロプロピルメチル	3- ([1, 2, 3] -トリアゾール-1-イル) -フェニル	
3656	シクロプロピルメチル	3- ([1, 2, 4] -トリアゾール-1-イル) -フェニル	
3657	シクロプロピルメチル	3- ([1, 2, 3] -トリアゾール-2-イル) -フェニル	
3658	シクロプロピルメチル	3- (4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル	
3659	シクロプロピルメチル	3- ([1, 2, 4] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	20
3660	シクロプロピルメチル	3- (2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
3661	シクロプロピルメチル	3- (4-メチル-4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル	
3662	シクロプロピルメチル	3- (2-メチル-2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
3663	シクロプロピルメチル	3- ([1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル	30
3664	シクロプロピルメチル	3- (5-メチル- [1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル	
3665	シクロプロピルメチル	3- ([1, 2, 4] -オキサジアゾール-3-イル) -フェニル	
3666	シクロプロピルメチル	3- (5-メチル- [1, 2, 4] -オキサジアゾール-3-イル) -フェニル	
3667	シクロプロピルメチル	3- ([1, 2, 4] -オキサジアゾール-5-イル) -フェニル	40

3668	シクロプロピルメチル	3-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-フェニル	
3669	シクロプロピルメチル	3-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	
3670	シクロプロピルメチル	3-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-フェニル	
3671	シクロプロピルメチル	3-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	10
3672	シクロプロピルメチル	3-(テトラゾール-1-イル)-フェニル	
3673	シクロプロピルメチル	3-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
3674	シクロプロピルメチル	3-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
3675	シクロプロピルメチル	3-フラザン-3-イル-フェニル	
3676	シクロプロピルメチル	3-(ピリド-2-イル)-フェニル	20
3677	シクロプロピルメチル	3-(ピリド-3-イル)-フェニル	
3678	シクロプロピルメチル	3-(ピリド-4-イル)-フェニル	
3679	シクロプロピルメチル	3-(ピリミジン-2-イル)-フェニル	
3680	シクロプロピルメチル	3-(2-メチルピリミジン-4-イル)-フェニル	
3681	シクロプロピルメチル	3-(ピリミジン-4-イル)-フェニル	
3682	シクロプロピルメチル	3-(ピリミジン-5-イル)-フェニル	
3683	シクロプロピルメチル	5-ブロモピリジン-3-イル	30
3684	シクロプロピルメチル	3-ブロモ-2-クロロピリジン-5-イル	
3685	シクロプロピルメチル	4-メチルピリジン-2-イル	
3686	シクロプロピルメチル	6-メチルピリジン-2-イル	
3687	シクロプロピルメチル	4-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル	
3688	シクロプロピルメチル	6-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル	
3689	シクロプロピルメチル	5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-3-イル	
3690	シクロプロピルメチル	5-(ピロリジン-1-イル)-ピリジン-3-イル	40
3691	シクロプロピルメチル	3-(ピロリジン-1-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	

3692	シクロプロピルメチル	3-(モルホリン-4-イル)-2-クロロピリジン-5-イル
3693	シクロプロピルメチル	2-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-5-イル
3694	シクロプロピルメチル	2-フェノキシピリジン-5-イル
3695	シクロプロピルメチル	4-メチルフェニル
3696	シクロプロピルメチル	4-エチルフェニル
3697	シクロプロピルメチル	4-プロピルフェニル
3698	シクロプロピルメチル	4-イソプロピルフェニル
3699	シクロプロピルメチル	4-sec-ブチルフェニル
3700	シクロプロピルメチル	4-tert-ブチルフェニル
3701	シクロプロピルメチル	4-イソブチルフェニル
3702	シクロプロピルメチル	4-(1,1-ジメチルプロピル)フェニル
3703	シクロプロピルメチル	4-ビニルフェニル
3704	シクロプロピルメチル	4-イソプロペニルフェニル
3705	シクロプロピルメチル	4-フルオロフェニル
3706	シクロプロピルメチル	4-クロロフェニル
3707	シクロプロピルメチル	4-ブロモフェニル
3708	シクロプロピルメチル	4-ヨードフェニル
3709	シクロプロピルメチル	4-(フルオロメチル)フェニル
3710	シクロプロピルメチル	4-(ジフルオロメチル)フェニル
3711	シクロプロピルメチル	4-(トリフルオロメチル)フェニル
3712	シクロプロピルメチル	2,4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル
3713	シクロプロピルメチル	4-(1-フルオロエチル)フェニル
3714	シクロプロピルメチル	4-( (S) -1-フルオロエチル)フェニル
3715	シクロプロピルメチル	4-( (R) -1-フルオロエチル)フェニル
3716	シクロプロピルメチル	4-(2-フルオロエチル)フェニル
3717	シクロプロピルメチル	4-(1,1-ジフルオロエチル)フェニル
3718	シクロプロピルメチル	4-(2,2-ジフルオロエチル)フェニル
3719	シクロプロピルメチル	4-(2,2,2-トリフルオロエチル)フェニル
3720	シクロプロピルメチル	4-(3-フルオロプロピル)フェニル
3721	シクロプロピルメチル	4-(2-フルオロプロピル)フェニル

10

20

30

40

3722	シクロプロピルメチル	4- ( (S) -2-フルオロプロピル) -フェニル	
3723	シクロプロピルメチル	4- ( (R) -2-フルオロプロピル) -フェニル	
3724	シクロプロピルメチル	4- (3, 3-ジフルオロプロピル) -フェニル	
3725	シクロプロピルメチル	4- (3, 3, 3-トリフルオロプロピル) -フェニル	
3726	シクロプロピルメチル	4- (1-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
3727	シクロプロピルメチル	4- (2-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
3728	シクロプロピルメチル	4- ( (S) -2-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	10
3729	シクロプロピルメチル	4- ( (R) -2-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
3730	シクロプロピルメチル	4- (2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
3731	シクロプロピルメチル	4- ( (S) -2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
3732	シクロプロピルメチル	4- ( (R) -2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
3733	シクロプロピルメチル	4- (2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	20
3734	シクロプロピルメチル	4- ( (S) -2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
3735	シクロプロピルメチル	4- ( (R) -2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル	
3736	シクロプロピルメチル	4- (2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル) -フェニル	
3737	シクロプロピルメチル	4- (1-ジフルオロメチル-2, 2-ジフルオロエチル) -フェニル	30
3738	シクロプロピルメチル	4- (1, 1-ジメチル-2-フルオロエチル) -フェニル	
3739	シクロプロピルメチル	4-メトキシフェニル	
3740	シクロプロピルメチル	4-エトキシフェニル	
3741	シクロプロピルメチル	4-プロポキシフェニル	
3742	シクロプロピルメチル	4-イソプロポキシフェニル	
3743	シクロプロピルメチル	4-ブトキシフェニル	40
3744	シクロプロピルメチル	4- (フルオロメトキシ) -フェニル	
3745	シクロプロピルメチル	4- (ジフルオロメトキシ) -フェニル	

3746	シクロプロピルメチル	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル
3747	シクロプロピルメチル	4-(2-フルオロエトキシ)フェニル
3748	シクロプロピルメチル	4-(2,2-ジフルオロエトキシ)フェニル
3749	シクロプロピルメチル	4-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)フェニル
3750	シクロプロピルメチル	4-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フェニル
3751	シクロプロピルメチル	4-シクロプロピルフェニル
3752	シクロプロピルメチル	4-シクロブチルフェニル
3753	シクロプロピルメチル	4-シクロペンチルフェニル
3754	シクロプロピルメチル	4-(2,2-ジフルオロシクロプロピル)フェニル
3755	シクロプロピルメチル	3,4-ジフルオロフェニル
3756	シクロプロピルメチル	4-ブromo-2-フルオロフェニル
3757	シクロプロピルメチル	2-ブromo-4-フルオロフェニル
3758	シクロプロピルメチル	4-ブromo-2,5-ジフルオロフェニル
3759	シクロプロピルメチル	5-ブromo-2,4-ジフルオロフェニル
3760	シクロプロピルメチル	3-ブromo-2,4-ジフルオロフェニル
3761	シクロプロピルメチル	3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル
3762	シクロプロピルメチル	4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル
3763	シクロプロピルメチル	3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
3764	シクロプロピルメチル	3-ブromo-4-(トリフルオロメチル)フェニル
3765	シクロプロピルメチル	5-ブromo-3-(トリフルオロメチル)フェニル
3766	シクロプロピルメチル	5-ブromo-2-(トリフルオロメチル)フェニル
3767	シクロプロピルメチル	2-ブromo-5-メトキシフェニル
3768	シクロプロピルメチル	4-ブromo-3-メトキシフェニル
3769	シクロプロピルメチル	3-フルオロ-2-イソプロピルフェニル
3770	シクロプロピルメチル	3-フルオロ-4-イソプロピルフェニル
3771	シクロプロピルメチル	4-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル
3772	シクロプロピルメチル	4-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)フェニル
3773	シクロプロピルメチル	4-アセチルフェニル
3774	シクロプロピルメチル	4-アセチルアミノフェニル
3775	シクロプロピルメチル	4-カルボキシフェニル

10

20

30

40

3776	シクロプロピルメチル	4-シアノフェニル
3777	シクロプロピルメチル	4-ニトロフェニル
3778	シクロプロピルメチル	4-ヒドロキシフェニル
3779	シクロプロピルメチル	4-(O-ベンジル) -フェニル
3780	シクロプロピルメチル	4-(2-メトキシエトキシ) -フェニル
3781	シクロプロピルメチル	4-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ) -フェニル
3782	シクロプロピルメチル	4-(NH-CO-NH <sub>2</sub> ) -フェニル
3783	シクロプロピルメチル	4-(メチルスルファニル) -フェニル
3784	シクロプロピルメチル	4-(フルオロメチルスルファニル) -フェニル
3785	シクロプロピルメチル	4-(ジフルオロメチルスルファニル) -フェニル
3786	シクロプロピルメチル	4-(トリフルオロメチルスルファニル) -フェニル
3787	シクロプロピルメチル	4-(メチルスルホニル) -フェニル
3788	シクロプロピルメチル	4-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ) -フェニル
3789	シクロプロピルメチル	4-(メトキシアミノ) -フェニル
3790	シクロプロピルメチル	4-(エトキシアミノ) -フェニル
3791	シクロプロピルメチル	4-(N-メチルアミノオキシ) -フェニル
3792	シクロプロピルメチル	4-(N, N-ジメチルアミノオキシ) -フェニル
3793	シクロプロピルメチル	4-(アゼチジン-1-イル) -フェニル
3794	シクロプロピルメチル	4-(2-メチルアゼチジン-1-イル) -フェニル
3795	シクロプロピルメチル	4-( (S) -2-メチルアゼチジン-1-イル) -フェニル
3796	シクロプロピルメチル	4-( (R) -2-メチルアゼチジン-1-イル) -フェニル
3797	シクロプロピルメチル	4-(3-フルオロアゼチジン-1-イル) -フェニル
3798	シクロプロピルメチル	4-(2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル) -フェニル
3799	シクロプロピルメチル	4-(2-メトキシアゼチジン-1-イル) -フェニル
3800	シクロプロピルメチル	4-(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル) -フェニル
3801	シクロプロピルメチル	4-(ピロリジン-1-イル) -フェニル
3802	シクロプロピルメチル	4-(ピロリジン-2-イル) -フェニル
3803	シクロプロピルメチル	4-( (S) -ピロリジン-2-イル) -フェニル
3804	シクロプロピルメチル	3-( (R) -ピロリジン-2-イル) -フェニル
3805	シクロプロピルメチル	4-(ピロリジン-3-イル) -フェニル

10

20

30

40

3806	シクロプロピルメチル	4-((S)-ピロリジン-3-イル)-フェニル	
3807	シクロプロピルメチル	4-((R)-ピロリジン-3-イル)-フェニル	
3808	シクロプロピルメチル	4-(ピロリジン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-フェニル	
3809	シクロプロピルメチル	4-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル	
3810	シクロプロピルメチル	4-(ピロリジン-1-イル)-3,4-メトキシフェニル	
3811	シクロプロピルメチル	4-(ピロリジン-1-イル)-2,5-ジフルオロフェニル	10
3812	シクロプロピルメチル	4-(ピロリジン-1-イル)-2,6-ジフルオロフェニル	
3813	シクロプロピルメチル	4-(2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
3814	シクロプロピルメチル	4-((S)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
3815	シクロプロピルメチル	4-((R)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	20
3816	シクロプロピルメチル	4-(3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
3817	シクロプロピルメチル	4-((S)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
3818	シクロプロピルメチル	4-((R)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
3819	シクロプロピルメチル	4-(2,2-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
3820	シクロプロピルメチル	4-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
3821	シクロプロピルメチル	4-(2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	30
3822	シクロプロピルメチル	4-((S)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3823	シクロプロピルメチル	4-((R)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3824	シクロプロピルメチル	4-(3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3825	シクロプロピルメチル	4-((S)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3826	シクロプロピルメチル	4-((R)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3827	シクロプロピルメチル	4-(1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
3828	シクロプロピルメチル	4-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	40
3829	シクロプロピルメチル	4-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
3830	シクロプロピルメチル	4-(1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	

3831	シクロプロピルメチル	4-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
3832	シクロプロピルメチル	4-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
3833	シクロプロピルメチル	4-(2,2-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3834	シクロプロピルメチル	4-(3,3-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3835	シクロプロピルメチル	4-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3836	シクロプロピルメチル	4-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	10
3837	シクロプロピルメチル	4-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3838	シクロプロピルメチル	4-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3839	シクロプロピルメチル	4-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	20
3840	シクロプロピルメチル	4-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
3841	シクロプロピルメチル	4-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル	
3842	シクロプロピルメチル	4-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル	
3843	シクロプロピルメチル	4-(ピペリジン-1-イル)-フェニル	
3844	シクロプロピルメチル	4-(2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
3845	シクロプロピルメチル	4-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	30
3846	シクロプロピルメチル	4-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
3847	シクロプロピルメチル	4-(2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
3848	シクロプロピルメチル	4-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
3849	シクロプロピルメチル	4-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
3850	シクロプロピルメチル	4-(2,2-ジフルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
3851	シクロプロピルメチル	4-(ピペラジン-1-イル)-フェニル	
3852	シクロプロピルメチル	4-(4-メチルピペラジン-1-イル)-フェニル	40
3853	シクロプロピルメチル	4-(モルホリン-4-イル)-フェニル	

3854	シクロプロピルメチル	4- (モルホリン-4-イル) -5- (トリフルオロメチル) -フェニル	
3855	シクロプロピルメチル	4- (モルホリン-4-イル) -2-メトキシフェニル	
3856	シクロプロピルメチル	4- (モルホリン-4-イル) -3-メトキシフェニル	
3857	シクロプロピルメチル	4- (モルホリン-4-イル) -2, 5-ジフルオロフェニル	
3858	シクロプロピルメチル	4- (モルホリン-4-イル) -2, 6-ジフルオロフェニル	
3859	シクロプロピルメチル	4- (チオモルホリン-4-イル) -フェニル	10
3860	シクロプロピルメチル	4- (1-オキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル	
3861	シクロプロピルメチル	4- (1, 1-ジオキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル	
3862	シクロプロピルメチル	4- (ピロール-1-イル) -フェニル	
3863	シクロプロピルメチル	4- (ピロール-2-イル) -フェニル	
3864	シクロプロピルメチル	4- (ピロール-3-イル) -フェニル	
3865	シクロプロピルメチル	4- (1-メチルピロール-2-イル) -フェニル	20
3866	シクロプロピルメチル	4- (1-メチルピロール-3-イル) -フェニル	
3867	シクロプロピルメチル	4- (フラン-2-イル) -フェニル	
3868	シクロプロピルメチル	4- (フラン-3-イル) -フェニル	
3869	シクロプロピルメチル	4- (チオフエン-2-イル) -フェニル	
3870	シクロプロピルメチル	4- (チオフエン-3-イル) -フェニル	
3871	シクロプロピルメチル	4- (5-プロピルチエン-2-イル) -フェニル	
3872	シクロプロピルメチル	4- (ピラゾール-1-イル) -フェニル	
3873	シクロプロピルメチル	4- (ピラゾール-3-イル) -フェニル	30
3874	シクロプロピルメチル	4- (ピラゾール-4-イル) -フェニル	
3875	シクロプロピルメチル	4- (4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル	
3876	シクロプロピルメチル	4- (1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル	
3877	シクロプロピルメチル	4- (1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル	
3878	シクロプロピルメチル	4- (1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) -フェニル	
3879	シクロプロピルメチル	4- (1H-イミダゾール-2-イル) -フェニル	40
3880	シクロプロピルメチル	4- (イミダゾール-1-イル) -フェニル	
3881	シクロプロピルメチル	4- (1-メチルイミダゾール-2-イル) -フェニル	

3882	シクロプロピルメチル	4- (オキサゾール-2-イル) -フェニル	
3883	シクロプロピルメチル	4- (オキサゾール-4-イル) -フェニル	
3884	シクロプロピルメチル	4- (オキサゾール-5-イル) -フェニル	
3885	シクロプロピルメチル	4- (イソオキサゾール-3-イル) -フェニル	
3886	シクロプロピルメチル	4- (イソオキサゾール-4-イル) -フェニル	
3887	シクロプロピルメチル	3- (イソオキサゾール-5-イル) -フェニル	
3888	シクロプロピルメチル	4- (チアゾール-2-イル) -フェニル	10
3889	シクロプロピルメチル	4- (チアゾール-4-イル) -フェニル	
3890	シクロプロピルメチル	4- (チアゾール-5-イル) -フェニル	
3891	シクロプロピルメチル	4- (2-メチルチアゾール-4-イル) -フェニル	
3892	シクロプロピルメチル	4- (4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル	
3893	シクロプロピルメチル	4- ([1, 2, 3]-トリアゾール-1-イル) -フェニル	
3894	シクロプロピルメチル	4- ([1, 2, 4]-トリアゾール-1-イル) -フェニル	
3895	シクロプロピルメチル	4- ([1, 2, 3]-トリアゾール-2-イル) -フェニル	20
3896	シクロプロピルメチル	4- (4H-[1, 2, 4]-トリアゾール-3-イル) -フェニル	
3897	シクロプロピルメチル	4- ([1, 2, 4]-トリアゾール-4-イル) -フェニル	
3898	シクロプロピルメチル	4- (2H-[1, 2, 3]-トリアゾール-4-イル) -フェニル	
3899	シクロプロピルメチル	4- (4-メチル-4H-[1, 2, 4]-トリアゾール-3-イル) -フェニル	30
3900	シクロプロピルメチル	4- (2-メチル-2H-[1, 2, 3]-トリアゾール-4-イル) -フェニル	
3901	シクロプロピルメチル	4- ([1, 3, 4]-オキサジアゾール-2-イル) -フェニル	
3902	シクロプロピルメチル	4- (5-メチル-[1, 3, 4]-オキサジアゾール-2-イル) -フェニル	
3903	シクロプロピルメチル	4- ([1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル) -フェニル	40

3904	シクロプロピルメチル	4-(5-メチル-[1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
3905	シクロプロピルメチル	4-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	
3906	シクロプロピルメチル	4-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-フェニル	
3907	シクロプロピルメチル	4-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	10
3908	シクロプロピルメチル	4-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-フェニル	
3909	シクロプロピルメチル	4-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
3910	シクロプロピルメチル	4-(テトラゾール-1-イル)-フェニル	
3911	シクロプロピルメチル	4-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	20
3912	シクロプロピルメチル	4-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
3913	シクロプロピルメチル	4-フラザン-3-イル-フェニル	
3914	シクロプロピルメチル	4-(ピリド-2-イル)-フェニル	
3915	シクロプロピルメチル	4-(ピリド-3-イル)-フェニル	
3916	シクロプロピルメチル	4-(ピリド-4-イル)-フェニル	
3917	シクロプロピルメチル	4-(ピリミジン-2-イル)-フェニル	30
3918	シクロプロピルメチル	4-(2-メチルピリミジン-4-イル)-フェニル	
3919	シクロプロピルメチル	4-(ピリミジン-4-イル)-フェニル	
3920	シクロプロピルメチル	4-(ピリミジン-5-イル)-フェニル	
3921	シクロプロピルメチル	4-ブromo-2-クロロピリジン-5-イル	
3922	シクロプロピルメチル	4-メチルピリジン-2-イル	
3923	シクロプロピルメチル	5-メチルピリジン-2-イル	
3924	シクロプロピルメチル	4-(ピロリジン-1-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	40
3925	シクロプロピルメチル	4-(モルホリン-4-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	

3926	シクロプロピルメチル	2-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-5-イル
3927	シクロプロピルメチル	5-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-2-イル
3928	シクロプロピルメチル	2-フェノキシピリジン-5-イル
3929	シクロプロピルメチル	2, 3-ジクロロフェニル
3930	シクロプロピルメチル	2, 5-ジクロロフェニル
3931	シクロプロピルメチル	3, 5-ジクロロフェニル
3932	シクロプロピルメチル	3-クロロ-4-フルオロフェニル
3933	シクロプロピルメチル	4-ブロモ-2, 5-ジクロロフェニル
3934	シクロプロピルメチル	3-ブロモ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル
3935	シクロプロピルメチル	3, 5-ジブロモ-4-(2-フルオロエトキシ)-フェニル
3936	シクロプロピルメチル	2, 5-ジメチルフェニル
3937	シクロプロピルメチル	2, 5-ジ-(トリフルオロメチル)-フェニル
3938	シクロプロピルメチル	3, 5-ジ-(トリフルオロメチル)-フェニル
3939	シクロプロピルメチル	2, 5-ジメトキシフェニル
3940	シクロプロピルメチル	2-メトキシ-5-メチルフェニル
3941	シクロプロピルメチル	2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)-フェニル
3942	シクロプロピルメチル	4-フルオロ-3-(オキサゾール-4-イル)-フェニル
3943	シクロプロピルメチル	チエン-2-イル
3944	シクロプロピルメチル	チエン-3-イル
3945	シクロプロピルメチル	3-クロロチエン-2-イル
3946	シクロプロピルメチル	4-クロロチエン-2-イル
3947	シクロプロピルメチル	5-クロロチエン-2-イル
3948	シクロプロピルメチル	3-ブロモチエン-2-イル
3949	シクロプロピルメチル	4-ブロモチエン-2-イル
3950	シクロプロピルメチル	5-ブロモチエン-2-イル
3951	シクロプロピルメチル	4, 5-ジクロロチエン-2-イル
3952	シクロプロピルメチル	4, 5-ジブロモチエン-2-イル
3953	シクロプロピルメチル	4-ブロモ-5-クロロチエン-2-イル
3954	シクロプロピルメチル	3-ブロモ-5-クロロチエン-2-イル
3955	シクロプロピルメチル	5-メチルチエン-2-イル

10

20

30

40

3956	シクロプロピルメチル	5-エチルチエン-2-イル
3957	シクロプロピルメチル	5-プロピルチエン-2-イル
3958	シクロプロピルメチル	5-トリフルオロメチルチエン-2-イル
3959	シクロプロピルメチル	5-フェニルチエン-2-イル
3960	シクロプロピルメチル	5-(ピリド-2-イル)-チエン-2-イル
3961	シクロプロピルメチル	5-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル
3962	シクロプロピルメチル	4-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル
3963	シクロプロピルメチル	5-(ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル
3964	シクロプロピルメチル	5-(3-クロロ-5-トリフルオロ-ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル
3965	シクロプロピルメチル	5-(ベンゾイルアミノメチル)-チエン-2-イル
3966	シクロプロピルメチル	5-(4-クロロベンゾイルアミノメチル)-チエン-2-イル
3967	シクロプロピルメチル	5-(アセチルアミノメチル)-チエン-2-イル
3968	シクロプロピルメチル	5-(ピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル
3969	シクロプロピルメチル	5-(ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
3970	シクロプロピルメチル	5-(ピラゾール-4-イル)-チエン-2-イル
3971	シクロプロピルメチル	5-(ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル
3972	シクロプロピルメチル	5-(4-フルオロピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル
3973	シクロプロピルメチル	5-(1-メチル-5-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
3974	シクロプロピルメチル	5-(1-メチル-3-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル
3975	シクロプロピルメチル	5-(4-カルボキシ-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
3976	シクロプロピルメチル	5-(4-アミノメチル-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
3977	シクロプロピルメチル	5-(イソキサゾール-3-イル)-チエン-2-イル
3978	シクロプロピルメチル	5-(イソキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
3979	シクロプロピルメチル	5-(イソキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル

10

20

30

40

3980	シクロプロピルメチル	5-(5-トリフルオロメチルイソキサゾール-3-イル)- チエン-2-イル
3981	シクロプロピルメチル	5-(オキサゾール-2-イル)-チエン-2-イル
3982	シクロプロピルメチル	5-(オキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
3983	シクロプロピルメチル	5-(オキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル
3984	シクロプロピルメチル	5-(2-メチルオキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
3985	シクロプロピルメチル	5-(2-メチルオキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル
3986	シクロプロピルメチル	5-(イソチアゾール-3-イル)-チエン-2-イル
3987	シクロプロピルメチル	5-(イソチアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
3988	シクロプロピルメチル	5-(イソチアゾール-5-イル)-チエン-2-イル
3989	シクロプロピルメチル	5-(5-トリフルオロメチルイソチアゾール-3-イル)-チ エン-2-イル
3990	シクロプロピルメチル	5-(チアゾール-2-イル)-チエン-2-イル
3991	シクロプロピルメチル	5-(チアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
3992	シクロプロピルメチル	5-(チアゾール-5-イル)-チエン-2-イル
3993	シクロプロピルメチル	5-(2-メチルチアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
3994	シクロプロピルメチル	5-(2-メチルチアゾール-5-イル)-チエン-2-イル
3995	シクロプロピルメチル	5-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-チエン -2-イル
3996	シクロプロピルメチル	5-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-チエン- 2-イル
3997	シクロプロピルメチル	5-(ピリミジン-2-イル)-チエン-2-イル
3998	シクロプロピルメチル	5-(ピリミジン-4-イル)-チエン-2-イル
3999	シクロプロピルメチル	5-(ピリミジン-5-イル)-チエン-2-イル
4000	シクロプロピルメチル	5-(2-メチルチオピリミジン-4-イル)-チエン-2-イ ル
4001	シクロプロピルメチル	5-([1, 3]-ジオキサラン-2-イル)-チエン-2-イ ル
4002	シクロプロピルメチル	5-([1, 3]-ジオキサラン-2-イル)-チエン-2-イ ルチエン-2-イル

10

20

30

40

4003	シクロプロピルメチル	5-(3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル)-メチル)-チエン-2-イル	
4004	シクロプロピルメチル	5-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-ピリド-2-イルスルホニル]-チエン-2-イル	
4005	シクロプロピルメチル	2-クロロチエン-3-イル	
4006	シクロプロピルメチル	4-クロロチエン-3-イル	
4007	シクロプロピルメチル	5-クロロチエン-3-イル	10
4008	シクロプロピルメチル	2-プロモチエン-3-イル	
4009	シクロプロピルメチル	4-プロモチエン-3-イル	
4010	シクロプロピルメチル	5-プロモチエン-3-イル	
4011	シクロプロピルメチル	2, 5-ジクロロチエン-3-イル	
4012	シクロプロピルメチル	2, 5-ジプロモチエン-3-イル	
4013	シクロプロピルメチル	2, 4, 5-トリクロロチエン-3-イル	
4014	シクロプロピルメチル	4-プロモ-2, 5-ジクロロチエン-3-イル	20
4015	シクロプロピルメチル	2-クロロ-5-メチルスルホニルチエン-3-イル	
4016	シクロプロピルメチル	2, 5-ジメチルチエン-3-イル	
4017	シクロプロピルメチル	4-ヒドロキシチエン-3-イル	
4018	シクロプロピルメチル	2-フェニルチエン-3-イル	
4019	シクロプロピルメチル	4-フェニル-5-(トリフルオロメチル)-チエン-3-イル	
4020	シクロプロピルメチル	2-メトキシカルボニル-4-フェニル-5-(トリフルオロメチル)-チエン-3-イル	30
4021	シクロプロピルメチル	ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
4022	シクロプロピルメチル	ベンゾ [b] チオフェン-3-イル	
4023	シクロプロピルメチル	3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
4024	シクロプロピルメチル	5-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
4025	シクロプロピルメチル	5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
4026	シクロプロピルメチル	5-クロロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
4027	シクロプロピルメチル	5-プロモ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	40
4028	アリル	3-メチルフェニル	
4029	アリル	3-エチルフェニル	

4030	アリル	3-プロピルフェニル
4031	アリル	3-イソプロピルフェニル
4032	アリル	3-sec-ブチルフェニル
4033	アリル	3-tert-ブチルフェニル
4034	アリル	3-イソブチルフェニル
4035	アリル	3-(1,1-ジメチルプロピル)-フェニル
4036	アリル	3-ビニルフェニル
4037	アリル	3-イソプロペニルフェニル
4038	アリル	3-フルオロフェニル
4039	アリル	2-フルオロフェニル
4040	アリル	3-クロロフェニル
4041	アリル	3-プロモフェニル
4042	アリル	3-ヨードフェニル
4043	アリル	3-(フルオロメチル)フェニル
4044	アリル	3-(ジフルオロメチル)フェニル
4045	アリル	3-(トリフルオロメチル)フェニル
4046	アリル	3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル
4047	アリル	3-(1-フルオロエチル)-フェニル
4048	アリル	3-((S)-1-フルオロエチル)-フェニル
4049	アリル	3-((R)-1-フルオロエチル)-フェニル
4050	アリル	3-(2-フルオロエチル)-フェニル
4051	アリル	3-(1,1-ジフルオロエチル)-フェニル
4052	アリル	3-(2,2-ジフルオロエチル)-フェニル
4053	アリル	3-(2,2,2-トリフルオロエチル)-フェニル
4054	アリル	3-(3-フルオロプロピル)-フェニル
4055	アリル	3-(2-フルオロプロピル)-フェニル
4056	アリル	3-((S)-2-フルオロプロピル)-フェニル
4057	アリル	3-((R)-2-フルオロプロピル)-フェニル
4058	アリル	3-(3,3-ジフルオロプロピル)-フェニル
4059	アリル	3-(3,3,3-トリフルオロプロピル)-フェニル

10

20

30

40

4060	アリル	3-(1-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
4061	アリル	3-(2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
4062	アリル	3-((S)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
4063	アリル	3-((R)-2-フルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
4064	アリル	3-(2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
4065	アリル	3-((S)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
4066	アリル	3-((R)-2,2-ジフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
4067	アリル	3-(2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
4068	アリル	3-((S)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
4069	アリル	3-((R)-2,2,2-トリフルオロ-1-メチルエチル)-フェニル
4070	アリル	3-(2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル)-フェニル
4071	アリル	3-(1-ジフルオロメチル-2,2-ジフルオロエチル)-フェニル
4072	アリル	3-(1,1-ジメチル-2-フルオロエチル)-フェニル
4073	アリル	3-メトキシフェニル
4074	アリル	3-エトキシフェニル
4075	アリル	3-プロポキシフェニル
4076	アリル	3-イソプロポキシフェニル
4077	アリル	3-ブトキシフェニル
4078	アリル	3-(フルオロメトキシ)-フェニル
4079	アリル	3-(ジフルオロメトキシ)-フェニル
4080	アリル	3-(トリフルオロメトキシ)-フェニル
4081	アリル	3-(2-フルオロエトキシ)-フェニル
4082	アリル	3-(2,2-ジフルオロエトキシ)-フェニル
4083	アリル	3-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-フェニル

10

20

30

40

4084	アリル	3-(1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) -フェニル
4085	アリル	3-シクロプロピルフェニル
4086	アリル	3-シクロブチルフェニル
4087	アリル	3-シクロペンチルフェニル
4088	アリル	3-(2, 2-ジフルオロシクロプロピル) -フェニル
4089	アリル	3, 4-ジフルオロフェニル
4090	アリル	3-ブロモ-2-フルオロフェニル
4091	アリル	2-ブロモ-3-フルオロフェニル
4092	アリル	3-ブロモ-2, 5-ジフルオロフェニル
4093	アリル	5-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
4094	アリル	3-ブロモ-2, 4-ジフルオロフェニル
4095	アリル	4-クロロ-3-(トリフルオロメチル) -フェニル
4096	アリル	2-クロロ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル
4097	アリル	2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル
4098	アリル	4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル) -フェニル
4099	アリル	3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル
4100	アリル	4-ブロモ-3-(トリフルオロメチル) -フェニル
4101	アリル	3-ブロモ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル
4102	アリル	2-ブロモ-5-(トリフルオロメチル) -フェニル
4103	アリル	5-ブロモ-2-メトキシフェニル
4104	アリル	3-ブロモ-4-メトキシフェニル
4105	アリル	2-フルオロ-2-イソプロピルフェニル
4106	アリル	4-フルオロ-3-イソプロピルフェニル
4107	アリル	3-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル) -フェニル
4108	アリル	3-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) -フェニル
4109	アリル	3-アセチルフェニル
4110	アリル	3-アセチルアミノフェニル
4111	アリル	3-カルボキシフェニル
4112	アリル	3-シアノフェニル
4113	アリル	3-ニトロフェニル

10

20

30

40

4114	アリル	3-ヒドロキシフェニル
4115	アリル	3-(O-ベンジル)フェニル
4116	アリル	3-(2-メトキシエトキシ)フェニル
4117	アリル	3-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )フェニル
4118	アリル	3-(NH-CO-NH <sub>2</sub> )フェニル
4119	アリル	3-(メチルスルファニル)フェニル
4120	アリル	3-(フルオロメチルスルファニル)フェニル
4121	アリル	3-(ジフルオロメチルスルファニル)フェニル
4122	アリル	3-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル
4123	アリル	3-(メチルスルホニル)フェニル
4124	アリル	3-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ)フェニル
4125	アリル	3-(メトキシアミノ)フェニル
4126	アリル	3-(エトキシアミノ)フェニル
4127	アリル	3-(N-メチルアミノオキシ)フェニル
4128	アリル	3-(N, N-ジメチルアミノオキシ)フェニル
4129	アリル	3-(アゼチジン-1-イル)フェニル
4130	アリル	3-(2-メチルアゼチジン-1-イル)フェニル
4131	アリル	3-((S)-2-メチルアゼチジン-1-イル)フェニル
4132	アリル	3-((R)-2-メチルアゼチジン-1-イル)フェニル
4133	アリル	3-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)フェニル
4134	アリル	3-(2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル)フェニル
4135	アリル	3-(2-メトキシアゼチジン-1-イル)フェニル
4136	アリル	3-(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル)フェニル
4137	アリル	3-(ピロリジン-1-イル)フェニル
4138	アリル	3-(ピロリジン-2-イル)フェニル
4139	アリル	3-((S)-ピロリジン-2-イル)フェニル
4140	アリル	3-((R)-ピロリジン-2-イル)フェニル
4141	アリル	3-(ピロリジン-3-イル)フェニル
4142	アリル	3-((S)-ピロリジン-3-イル)フェニル
4143	アリル	3-((R)-ピロリジン-3-イル)フェニル

10

20

30

40

4144	アリル	3-(ピロリジン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)-フェニル	
4145	アリル	5-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル	
4146	アリル	3-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル	
4147	アリル	5-(ピロリジン-1-イル)-2,4-ジフルオロフェニル	
4148	アリル	3-(ピロリジン-1-イル)-2,4-ジフルオロフェニル	
4149	アリル	3-(2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	10
4150	アリル	3-((S)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
4151	アリル	3-((R)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
4152	アリル	3-(3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
4153	アリル	3-((S)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	20
4154	アリル	3-((R)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
4155	アリル	3-(2,2-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
4156	アリル	3-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
4157	アリル	3-(2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4158	アリル	3-((S)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4159	アリル	3-((R)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	30
4160	アリル	3-(3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4161	アリル	3-((S)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4162	アリル	3-((R)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4163	アリル	3-(1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
4164	アリル	3-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
4165	アリル	3-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
4166	アリル	3-(1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	40
4167	アリル	3-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
4168	アリル	3-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	

4169	アリル	3-(2,2-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4170	アリル	3-(3,3-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4171	アリル	3-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4172	アリル	3-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4173	アリル	3-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	10
4174	アリル	3-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4175	アリル	3-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4176	アリル	3-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	20
4177	アリル	3-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル	
4178	アリル	3-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル	
4179	アリル	3-(ピペリジン-1-イル)-フェニル	
4180	アリル	3-(2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
4181	アリル	3-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
4182	アリル	3-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
4183	アリル	3-(2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	30
4184	アリル	3-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
4185	アリル	3-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
4186	アリル	3-(2,2-ジフルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
4187	アリル	3-(ピペラジン-1-イル)-フェニル	
4188	アリル	3-(4-メチルピペラジン-1-イル)-フェニル	
4189	アリル	3-(モルホリン-4-イル)-フェニル	
4190	アリル	3-(モルホリン-4-イル)-5-(トリフルオロメチル)-フェニル	40
4191	アリル	5-(モルホリン-4-イル)-2-メトキシフェニル	

4192	アリル	3- (モルホリン-4-イル) -4-メトキシフェニル
4193	アリル	5- (モルホリン-4-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル
4194	アリル	3- (モルホリン-4-イル) -2, 4-ジフルオロフェニル
4195	アリル	3- (チオモルホリン-4-イル) -フェニル
4196	アリル	3- (1-オキソチオモルホリン-4-イル) -フェニル
4197	アリル	3- (1, 1-ジオキソチオモルホリン-4-イル) -フェニル
4198	アリル	3- (ピロール-1-イル) -フェニル
4199	アリル	3- (ピロール-2-イル) -フェニル
4200	アリル	3- (ピロール-3-イル) -フェニル
4201	アリル	3- (1-メチルピロール-2-イル) -フェニル
4202	アリル	3- (1-メチルピロール-3-イル) -フェニル
4203	アリル	3- (フラン-2-イル) -フェニル
4204	アリル	3- (フラン-3-イル) -フェニル
4205	アリル	3- (チオフェン-2-イル) -フェニル
4206	アリル	3- (チオフェン-3-イル) -フェニル
4207	アリル	3- (5-プロピルチエン-2-イル) -フェニル
4208	アリル	3- (ピラゾール-1-イル) -フェニル
4209	アリル	3- (ピラゾール-3-イル) -フェニル
4210	アリル	3- (ピラゾール-4-イル) -フェニル
4211	アリル	3- (4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル
4212	アリル	3- (1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
4213	アリル	3- (1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル
4214	アリル	3- (1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) -フェニル
4215	アリル	3- (1H-イミダゾール-2-イル) -フェニル
4216	アリル	3- (イミダゾール-1-イル) -フェニル
4217	アリル	3- (1-メチルイミダゾール-2-イル) -フェニル
4218	アリル	3- (オキサゾール-2-イル) -フェニル
4219	アリル	3- (オキサゾール-4-イル) -フェニル
4220	アリル	3- (オキサゾール-5-イル) -フェニル
4221	アリル	3- (イソオキサゾール-3-イル) -フェニル

10

20

30

40

4 2 2 2	アリル	3- (イソオキサゾール-4-イル) -フェニル	
4 2 2 3	アリル	3- (イソオキサゾール-5-イル) -フェニル	
4 2 2 4	アリル	3- (チアゾール-2-イル) -フェニル	
4 2 2 5	アリル	3- (チアゾール-4-イル) -フェニル	
4 2 2 6	アリル	3- (チアゾール-5-イル) -フェニル	
4 2 2 7	アリル	3- (2-メチルチアゾール-4-イル) -フェニル	
4 2 2 8	アリル	3- (2-メチルチアゾール-5-イル) -フェニル	10
4 2 2 9	アリル	3- ([1, 2, 3] -トリアゾール-1-イル) -フェニル	
4 2 3 0	アリル	3- ([1, 2, 4] -トリアゾール-1-イル) -フェニル	
4 2 3 1	アリル	3- ([1, 2, 3] -トリアゾール-2-イル) -フェニル	
4 2 3 2	アリル	3- (4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル	
4 2 3 3	アリル	3- ([1, 2, 4] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	20
4 2 3 4	アリル	3- (2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
4 2 3 5	アリル	3- (4-メチル-4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル	
4 2 3 6	アリル	3- (2-メチル-2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル	
4 2 3 7	アリル	3- ([1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル	30
4 2 3 8	アリル	3- (5-メチル- [1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル	
4 2 3 9	アリル	3- ([1, 2, 4] -オキサジアゾール-3-イル) -フェニル	
4 2 4 0	アリル	3- (5-メチル- [1, 2, 4] -オキサジアゾール-3-イル) -フェニル	
4 2 4 1	アリル	3- ([1, 2, 4] -オキサジアゾール-5-イル) -フェニル	40

4242	アリル	3-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-フェニル	
4243	アリル	3-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	
4244	アリル	3-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-フェニル	
4245	アリル	3-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	10
4246	アリル	3-(テトラゾール-1-イル)-フェニル	
4247	アリル	3-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
4248	アリル	3-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
4249	アリル	3-フラザン-3-イル-フェニル	
4250	アリル	3-(ピリド-2-イル)-フェニル	20
4251	アリル	3-(ピリド-3-イル)-フェニル	
4252	アリル	3-(ピリド-4-イル)-フェニル	
4253	アリル	3-(ピリミジン-2-イル)-フェニル	
4254	アリル	3-(2-メチルピリミジン-4-イル)-フェニル	
4255	アリル	3-(ピリミジン-4-イル)-フェニル	
4256	アリル	3-(ピリミジン-5-イル)-フェニル	
4257	アリル	5-プロモピリジン-3-イル	30
4258	アリル	3-プロモ-2-クロロピリジン-5-イル	
4259	アリル	4-メチルピリジン-2-イル	
4260	アリル	6-メチルピリジン-2-イル	
4261	アリル	4-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル	
4262	アリル	6-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル	
4263	アリル	5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-3-イル	
4264	アリル	5-(ピロリジン-1-イル)-ピリジン-3-イル	40
4265	アリル	3-(ピロリジン-1-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	

4266	アリル	3-(モルホリン-4-イル)-2-クロロピリジン-5-イル
4267	アリル	2-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-5-イル
4268	アリル	2-フェノキシピリジン-5-イル
4269	アリル	4-メチルフェニル
4270	アリル	4-エチルフェニル
4271	アリル	4-プロピルフェニル
4272	アリル	4-イソプロピルフェニル
4273	アリル	4-sec-ブチルフェニル
4274	アリル	4-tert-ブチルフェニル
4275	アリル	4-イソブチルフェニル
4276	アリル	4-(1,1-ジメチルプロピル)-フェニル
4277	アリル	4-ビニルフェニル
4278	アリル	4-イソプロペニルフェニル
4279	アリル	4-フルオロフェニル
4280	アリル	4-クロロフェニル
4281	アリル	4-プロモフェニル
4282	アリル	4-ヨードフェニル
4283	アリル	4-(フルオロメチル)フェニル
4284	アリル	4-(ジフルオロメチル)フェニル
4285	アリル	4-(トリフルオロメチル)フェニル
4286	アリル	2,4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル
4287	アリル	4-(1-フルオロエチル)-フェニル
4288	アリル	4-((S)-1-フルオロエチル)-フェニル
4289	アリル	4-((R)-1-フルオロエチル)-フェニル
4290	アリル	4-(2-フルオロエチル)-フェニル
4291	アリル	4-(1,1-ジフルオロエチル)-フェニル
4292	アリル	4-(2,2-ジフルオロエチル)-フェニル
4293	アリル	4-(2,2,2-トリフルオロエチル)-フェニル
4294	アリル	4-(3-フルオロプロピル)-フェニル
4295	アリル	4-(2-フルオロプロピル)-フェニル

10

20

30

40

4296	アリル	4- ( (S) -2-フルオロプロピル) -フェニル
4297	アリル	4- ( (R) -2-フルオロプロピル) -フェニル
4298	アリル	4- (3, 3-ジフルオロプロピル) -フェニル
4299	アリル	4- (3, 3, 3-トリフルオロプロピル) -フェニル
4300	アリル	4- (1-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル
4301	アリル	4- (2-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル
4302	アリル	4- ( (S) -2-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル
4303	アリル	4- ( (R) -2-フルオロ-1-メチルエチル) -フェニル
4304	アリル	4- (2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル
4305	アリル	4- ( (S) -2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル
4306	アリル	4- ( (R) -2, 2-ジフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル
4307	アリル	4- (2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル
4308	アリル	4- ( (S) -2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル
4309	アリル	4- ( (R) -2, 2, 2-トリフルオロ-1-メチルエチル) -フェニル
4310	アリル	4- (2-フルオロ-1-フルオロメチルエチル) -フェニル
4311	アリル	4- (1-ジフルオロメチル-2, 2-ジフルオロエチル) -フェニル
4312	アリル	4- (1, 1-ジメチル-2-フルオロエチル) -フェニル
4313	アリル	4-メトキシフェニル
4314	アリル	4-エトキシフェニル
4315	アリル	4-プロポキシフェニル
4316	アリル	4-イソプロポキシフェニル
4317	アリル	4-ブトキシフェニル
4318	アリル	4- (フルオロメトキシ) -フェニル
4319	アリル	4- (ジフルオロメトキシ) -フェニル

10

20

30

40

4320	アリル	4-(トリフルオロメトキシ)フェニル
4321	アリル	4-(2-フルオロエトキシ)フェニル
4322	アリル	4-(2,2-ジフルオロエトキシ)フェニル
4323	アリル	4-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)フェニル
4324	アリル	4-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フェニル
4325	アリル	4-シクロプロピルフェニル
4326	アリル	4-シクロブチルフェニル
4327	アリル	4-シクロペンチルフェニル
4328	アリル	4-(2,2-ジフルオロシクロプロピル)フェニル
4329	アリル	3,4-ジフルオロフェニル
4330	アリル	4-ブロモ-2-フルオロフェニル
4331	アリル	2-ブロモ-4-フルオロフェニル
4332	アリル	4-ブロモ-2,5-ジフルオロフェニル
4333	アリル	5-ブロモ-2,4-ジフルオロフェニル
4334	アリル	3-ブロモ-2,4-ジフルオロフェニル
4335	アリル	3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル
4336	アリル	4-フルオロ-3-(トリフルオロメチル)フェニル
4337	アリル	3-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
4338	アリル	3-ブロモ-4-(トリフルオロメチル)フェニル
4339	アリル	5-ブロモ-3-(トリフルオロメチル)フェニル
4340	アリル	5-ブロモ-2-(トリフルオロメチル)フェニル
4341	アリル	2-ブロモ-5-メトキシフェニル
4342	アリル	4-ブロモ-3-メトキシフェニル
4343	アリル	3-フルオロ-2-イソプロピルフェニル
4344	アリル	3-フルオロ-4-イソプロピルフェニル
4345	アリル	4-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)フェニル
4346	アリル	4-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)フェニル
4347	アリル	4-アセチルフェニル
4348	アリル	4-アセチルアミノフェニル
4349	アリル	4-カルボキシフェニル

10

20

30

40

4350	アリル	4-シアノフェニル
4351	アリル	4-ニトロフェニル
4352	アリル	4-ヒドロキシフェニル
4353	アリル	4-(O-ベンジル)フェニル
4354	アリル	4-(2-メトキシエトキシ)フェニル
4355	アリル	4-(CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )フェニル
4356	アリル	4-(NH-CO-NH <sub>2</sub> )フェニル
4357	アリル	4-(メチルスルファニル)フェニル
4358	アリル	4-(フルオロメチルスルファニル)フェニル
4359	アリル	4-(ジフルオロメチルスルファニル)フェニル
4360	アリル	4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル
4361	アリル	4-(メチルスルホニル)フェニル
4362	アリル	4-(N-メトキシ-N-メチル-アミノ)フェニル
4363	アリル	4-(メトキシアミノ)フェニル
4364	アリル	4-(エトキシアミノ)フェニル
4365	アリル	4-(N-メチルアミノオキシ)フェニル
4366	アリル	4-(N, N-ジメチルアミノオキシ)フェニル
4367	アリル	4-(アゼチジン-1-イル)フェニル
4368	アリル	4-(2-メチルアゼチジン-1-イル)フェニル
4369	アリル	4-( (S) -2-メチルアゼチジン-1-イル)フェニル
4370	アリル	4-( (R) -2-メチルアゼチジン-1-イル)フェニル
4371	アリル	4-(3-フルオロアゼチジン-1-イル)フェニル
4372	アリル	4-(2, 2-ジフルオロアゼチジン-1-イル)フェニル
4373	アリル	4-(2-メトキシアゼチジン-1-イル)フェニル
4374	アリル	4-(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル)フェニル
4375	アリル	4-(ピロリジン-1-イル)フェニル
4376	アリル	4-(ピロリジン-2-イル)フェニル
4377	アリル	4-( (S) -ピロリジン-2-イル)フェニル
4378	アリル	3-( (R) -ピロリジン-2-イル)フェニル
4379	アリル	4-(ピロリジン-3-イル)フェニル

10

20

30

40

4380	アリル	4-((S)-ピロリジン-3-イル)-フェニル	
4381	アリル	4-((R)-ピロリジン-3-イル)-フェニル	
4382	アリル	4-(ピロリジン-1-イル)-5-(トリフルオロメチル)- フェニル	
4383	アリル	4-(ピロリジン-1-イル)-2-メトキシフェニル	
4384	アリル	4-(ピロリジン-1-イル)-3,4-メトキシフェニル	
4385	アリル	4-(ピロリジン-1-イル)-2,5-ジフルオロフェニル	10
4386	アリル	4-(ピロリジン-1-イル)-2,6-ジフルオロフェニル	
4387	アリル	4-(2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
4388	アリル	4-((S)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
4389	アリル	4-((R)-2-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
4390	アリル	4-(3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	20
4391	アリル	4-((S)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
4392	アリル	4-((R)-3-フルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
4393	アリル	4-(2,2-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
4394	アリル	4-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)-フェニル	
4395	アリル	4-(2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	30
4396	アリル	4-((S)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4397	アリル	4-((R)-2-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4398	アリル	4-(3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4399	アリル	4-((S)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4400	アリル	4-((R)-3-メチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4401	アリル	4-(1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
4402	アリル	4-((S)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	40
4403	アリル	4-((R)-1-メチルピロリジン-2-イル)-フェニル	
4404	アリル	4-(1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	

4405	アリル	4-((S)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
4406	アリル	4-((R)-1-メチルピロリジン-3-イル)-フェニル	
4407	アリル	4-(2,2-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4408	アリル	4-(3,3-ジメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4409	アリル	4-(2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4410	アリル	4-((S)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	10
4411	アリル	4-((R)-2-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4412	アリル	4-(3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4413	アリル	4-((S)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	20
4414	アリル	4-((R)-3-トリフルオロメチルピロリジン-1-イル)-フェニル	
4415	アリル	4-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル	
4416	アリル	4-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-イル)-フェニル	
4417	アリル	4-(ピペリジン-1-イル)-フェニル	
4418	アリル	4-(2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
4419	アリル	4-((S)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	30
4420	アリル	4-((R)-2-メチルピペリジン-1-イル)-フェニル	
4421	アリル	4-(2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
4422	アリル	4-((S)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
4423	アリル	4-((R)-2-フルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
4424	アリル	4-(2,2-ジフルオロピペリジン-1-イル)-フェニル	
4425	アリル	4-(ピペラジン-1-イル)-フェニル	
4426	アリル	4-(4-メチルピペラジン-1-イル)-フェニル	40
4427	アリル	4-(モルホリン-4-イル)-フェニル	

4428	アリル	4- (モルホリン-4-イル) -5- (トリフルオロメチル) -フェニル	
4429	アリル	4- (モルホリン-4-イル) -2-メトキシフェニル	
4430	アリル	4- (モルホリン-4-イル) -3-メトキシフェニル	
4431	アリル	4- (モルホリン-4-イル) -2, 5-ジフルオロフェニル	
4432	アリル	4- (モルホリン-4-イル) -2, 6-ジフルオロフェニル	
4433	アリル	4- (チオモルホリン-4-イル) -フェニル	10
4434	アリル	4- (1-オキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル	
4435	アリル	4- (1, 1-ジオキソ-チオモルホリン-4-イル) -フェニル	
4436	アリル	4- (ピロール-1-イル) -フェニル	
4437	アリル	4- (ピロール-2-イル) -フェニル	
4438	アリル	4- (ピロール-3-イル) -フェニル	
4439	アリル	4- (1-メチルピロール-2-イル) -フェニル	
4440	アリル	4- (1-メチルピロール-3-イル) -フェニル	20
4441	アリル	4- (フラン-2-イル) -フェニル	
4442	アリル	4- (フラン-3-イル) -フェニル	
4443	アリル	4- (チオフエン-2-イル) -フェニル	
4444	アリル	4- (チオフエン-3-イル) -フェニル	
4445	アリル	4- (5-プロピルチエン-2-イル) -フェニル	
4446	アリル	4- (ピラゾール-1-イル) -フェニル	
4447	アリル	4- (ピラゾール-3-イル) -フェニル	30
4448	アリル	4- (ピラゾール-4-イル) -フェニル	
4449	アリル	4- (4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル	
4450	アリル	4- (1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル	
4451	アリル	4- (1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル) -フェニル	
4452	アリル	4- (1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) -フェニル	
4453	アリル	4- (1H-イミダゾール-2-イル) -フェニル	
4454	アリル	4- (イミダゾール-1-イル) -フェニル	40
4455	アリル	4- (1-メチルイミダゾール-2-イル) -フェニル	

4456	アリル	4- (オキサゾール-2-イル) -フェニル
4457	アリル	4- (オキサゾール-4-イル) -フェニル
4458	アリル	4- (オキサゾール-5-イル) -フェニル
4459	アリル	4- (イソオキサゾール-3-イル) -フェニル
4460	アリル	4- (イソオキサゾール-4-イル) -フェニル
4461	アリル	3- (イソオキサゾール-5-イル) -フェニル
4462	アリル	4- (チアゾール-2-イル) -フェニル
4463	アリル	4- (チアゾール-4-イル) -フェニル
4464	アリル	4- (チアゾール-5-イル) -フェニル
4465	アリル	4- (2-メチルチアゾール-4-イル) -フェニル
4466	アリル	4- (4-フルオロピラゾール-1-イル) -フェニル
4467	アリル	4- ([1, 2, 3] -トリアゾール-1-イル) -フェニル
4468	アリル	4- ([1, 2, 4] -トリアゾール-1-イル) -フェニル
4469	アリル	4- ([1, 2, 3] -トリアゾール-2-イル) -フェニル
4470	アリル	4- (4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル
4471	アリル	4- ([1, 2, 4] -トリアゾール-4-イル) -フェニル
4472	アリル	4- (2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル
4473	アリル	4- (4-メチル-4H- [1, 2, 4] -トリアゾール-3-イル) -フェニル
4474	アリル	4- (2-メチル-2H- [1, 2, 3] -トリアゾール-4-イル) -フェニル
4475	アリル	4- ([1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル
4476	アリル	4- (5-メチル- [1, 3, 4] -オキサジアゾール-2-イル) -フェニル
4477	アリル	4- ([1, 2, 4] -オキサジアゾール-3-イル) -フェニル

10

20

30

40

4478	アリル	4-(5-メチル-[1, 2, 4]-オキサジアゾール-3-イル)-フェニル	
4479	アリル	4-([1, 2, 4]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	
4480	アリル	4-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-フェニル	
4481	アリル	4-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-5-イル)-フェニル	10
4482	アリル	4-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-フェニル	
4483	アリル	4-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
4484	アリル	4-(テトラゾール-1-イル)-フェニル	
4485	アリル	4-(2-メチル-2H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	20
4486	アリル	4-(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル	
4487	アリル	4-フラザン-3-イル-フェニル	
4488	アリル	4-(ピリド-2-イル)-フェニル	
4489	アリル	4-(ピリド-3-イル)-フェニル	
4490	アリル	4-(ピリド-4-イル)-フェニル	
4491	アリル	4-(ピリミジン-2-イル)-フェニル	30
4492	アリル	4-(2-メチルピリミジン-4-イル)-フェニル	
4493	アリル	4-(ピリミジン-4-イル)-フェニル	
4494	アリル	4-(ピリミジン-5-イル)-フェニル	
4495	アリル	4-プロモ-2-クロロピリジン-5-イル	
4496	アリル	4-メチルピリジン-2-イル	
4497	アリル	5-メチルピリジン-2-イル	
4498	アリル	4-(ピロリジン-1-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	40
4499	アリル	4-(モルホリン-4-イル)-2-クロロピリジン-5-イル	

4500	アリル	2-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-5-イル
4501	アリル	5-(モルホリン-4-イル)-ピリジン-2-イル
4502	アリル	2-フェノキシピリジン-5-イル
4503	アリル	2,3-ジクロロフェニル
4504	アリル	2,5-ジクロロフェニル
4505	アリル	3,5-ジクロロフェニル
4506	アリル	3-クロロ-4-フルオロフェニル
4507	アリル	4-ブロモ-2,5-ジクロロフェニル
4508	アリル	3-ブロモ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル
4509	アリル	3,5-ジブロモ-4-(2-フルオロエトキシ)フェニル
4510	アリル	2,5-ジメチルフェニル
4511	アリル	2,5-ジ-(トリフルオロメチル)フェニル
4512	アリル	3,5-ジ-(トリフルオロメチル)フェニル
4513	アリル	2,5-ジメトキシフェニル
4514	アリル	2-メトキシ-5-メチルフェニル
4515	アリル	2-メトキシ-5-(トリフルオロメチル)フェニル
4516	アリル	4-フルオロ-3-(オキサゾール-4-イル)フェニル
4517	アリル	チエン-2-イル
4518	アリル	チエン-3-イル
4519	アリル	3-クロロチエン-2-イル
4520	アリル	4-クロロチエン-2-イル
4521	アリル	5-クロロチエン-2-イル
4522	アリル	3-ブロモチエン-2-イル
4523	アリル	4-ブロモチエン-2-イル
4524	アリル	5-ブロモチエン-2-イル
4525	アリル	4,5-ジクロロチエン-2-イル
4526	アリル	4,5-ジブロモチエン-2-イル
4527	アリル	4-ブロモ-5-クロロチエン-2-イル
4528	アリル	3-ブロモ-5-クロロチエン-2-イル
4529	アリル	5-メチルチエン-2-イル

10

20

30

40

4530	アリル	5-エチルチエン-2-イル
4531	アリル	5-プロピルチエン-2-イル
4532	アリル	5-トリフルオロメチルチエン-2-イル
4533	アリル	5-フェニルチエン-2-イル
4534	アリル	5-(ピリド-2-イル)-チエン-2-イル
4535	アリル	5-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル
4536	アリル	4-(フェニルスルホニル)-チエン-2-イル
4537	アリル	5-(ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル
4538	アリル	5-(3-クロロ-5-トリフルオロ-ピリド-2-イルスルホニル)-チエン-2-イル
4539	アリル	5-(ベンゾイルアミノメチル)-チエン-2-イル
4540	アリル	5-((4-クロロベンゾイル)アミノメチル)-チエン-2-イル
4541	アリル	5-(アセチルアミノメチル)-チエン-2-イル
4542	アリル	5-(ピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル
4543	アリル	5-(ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
4544	アリル	5-(ピラゾール-4-イル)-チエン-2-イル
4545	アリル	5-(ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル
4546	アリル	5-(4-フルオロピラゾール-1-イル)-チエン-2-イル
4547	アリル	5-(1-メチル-5-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
4548	アリル	5-(1-メチル-3-トリフルオロメチル-(1H)-ピラゾール-5-イル)-チエン-2-イル
4549	アリル	5-(4-カルボキシ-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
4550	アリル	5-(4-アミノメチル-1-メチル-5-メチルチオ-(1H)-ピラゾール-3-イル)-チエン-2-イル
4551	アリル	5-(イソキサゾール-3-イル)-チエン-2-イル
4552	アリル	5-(イソキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
4553	アリル	5-(イソキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル

10

20

30

40

4554	アリル	5-(5-トリフルオロメチルイソキサゾール-3-イル)- チエン-2-イル
4555	アリル	5-(オキサゾール-2-イル)-チエン-2-イル
4556	アリル	5-(オキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
4557	アリル	5-(オキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル
4558	アリル	5-(2-メチルオキサゾール-4-イル)-チエン-2-イル
4559	アリル	5-(2-メチルオキサゾール-5-イル)-チエン-2-イル
4560	アリル	5-(イソチアゾール-3-イル)-チエン-2-イル
4561	アリル	5-(イソチアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
4562	アリル	5-(イソチアゾール-5-イル)-チエン-2-イル
4563	アリル	5-(5-トリフルオロメチルイソチアゾール-3-イル)-チ エン-2-イル
4564	アリル	5-(チアゾール-2-イル)-チエン-2-イル
4565	アリル	5-(チアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
4566	アリル	5-(チアゾール-5-イル)-チエン-2-イル
4567	アリル	5-(2-メチルチアゾール-4-イル)-チエン-2-イル
4568	アリル	5-(2-メチルチアゾール-5-イル)-チエン-2-イル
4569	アリル	5-([1, 2, 3]-オキサジアゾール-4-イル)-チエン -2-イル
4570	アリル	5-([1, 2, 3]-チアジアゾール-4-イル)-チエン- 2-イル
4571	アリル	5-(ピリミジン-2-イル)-チエン-2-イル
4572	アリル	5-(ピリミジン-4-イル)-チエン-2-イル
4573	アリル	5-(ピリミジン-5-イル)-チエン-2-イル
4574	アリル	5-(2-メチルチオピリミジン-4-イル)-チエン-2-イ ル
4575	アリル	5-([1, 3]-ジオキサラン-2-イル)-チエン-2-イ ル
4576	アリル	5-([1, 3]-ジオキサラン-2-イル)-チエン-2-イ ルチエン-2-イル

10

20

30

40

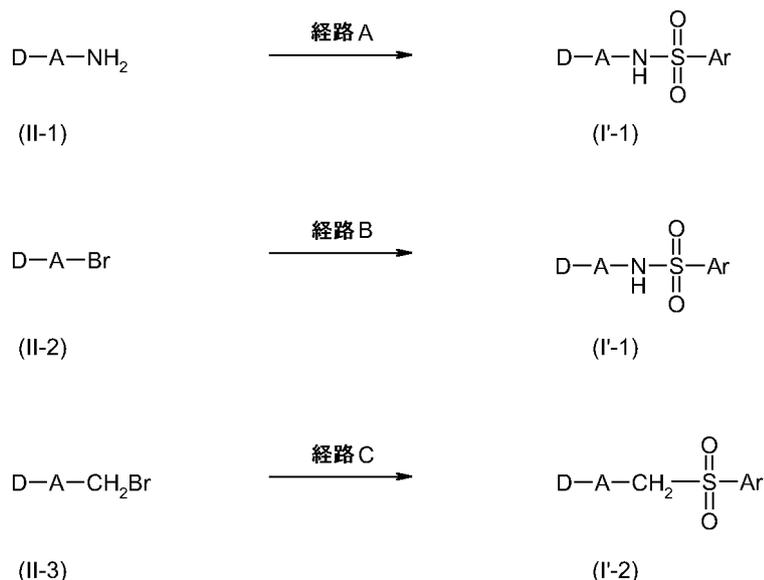
4577	アリル	5-(3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-ピリジン-2-イル)-メチル)-チエン-2-イル	
4578	アリル	5-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)-ピリド-2-イルスルホニル]-チエン-2-イル	
4579	アリル	2-クロロチエン-3-イル	
4580	アリル	4-クロロチエン-3-イル	
4581	アリル	5-クロロチエン-3-イル	10
4582	アリル	2-ブロモチエン-3-イル	
4583	アリル	4-ブロモチエン-3-イル	
4584	アリル	5-ブロモチエン-3-イル	
4585	アリル	2, 5-ジクロロチエン-3-イル	
4586	アリル	2, 5-ジブロモチエン-3-イル	
4587	アリル	2, 4, 5-トリクロロチエン-3-イル	
4588	アリル	4-ブロモ-2, 5-ジクロロチエン-3-イル	20
4589	アリル	2-クロロ-5-メチルスルホニルチエン-3-イル	
4590	アリル	2, 5-ジメチルチエン-3-イル	
4591	アリル	4-ヒドロキシチエン-3-イル	
4592	アリル	2-フェニルチエン-3-イル	
4593	アリル	4-フェニル-5-(トリフルオロメチル)-チエン-3-イル	
4594	アリル	2-メトキシカルボニル-4-フェニル-5-(トリフルオロメチル)-チエン-3-イル	30
4595	アリル	ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
4596	アリル	ベンゾ [b] チオフェン-3-イル	
4597	アリル	3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
4598	アリル	5-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
4599	アリル	5-フルオロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
4600	アリル	5-クロロ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	
4601	アリル	5-ブロモ-3-メチル-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル	40

## 【0105】

本発明の化合物 I は、下記の合成経路 A、B および C で示した方法に従って合成することができる。

## 【0106】

## 【化9】



10

図式1:

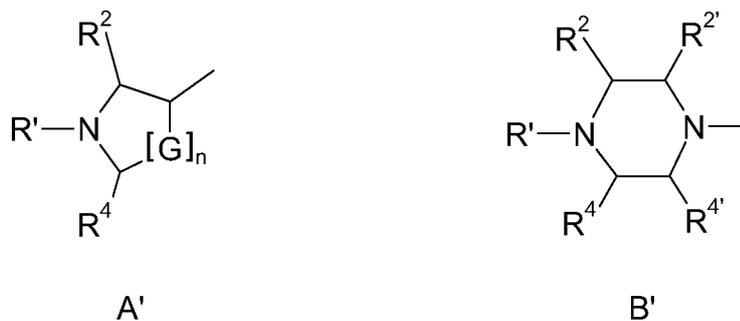
## 【0107】

20

図式1において、AおよびAr、n、R<sup>2</sup>およびR<sup>4</sup>は上記で定義の通りである。Dは、式AまたはBの基である。

## 【0108】

## 【化10】



30

式中、G、n、R<sup>2</sup>、R<sup>2'</sup>、R<sup>4</sup>およびR<sup>4'</sup>は上記で定義の通りであり、RはR<sup>1</sup>であり、またはR<sup>1</sup>の前駆体である。

## 【0109】

## 経路A

経路Aにおいて、アミノ化合物(II-1)を、好適なスルホン酸誘導体と反応させて、スルホンアミド(I-1)(E=NH)を得る。好適なスルホン酸誘導体は、例えばスルホニルクロライドAr-SO<sub>2</sub>Clである。そのスルホン化反応は好ましくは、当業界での標準的な手順に従い、塩基存在下に行う。上記図式1に示した反応では、スルホン化は、それぞれアリールスルホンアミド化合物またはアリールスルホン酸エステルの製造において一般的な反応条件下で行い、その条件については、文献(例えば、J. March, Advanced Organic Chemistry, 3<sup>rd</sup> edition, John Wiley & Sons, New York, 1985 p 444ff およびそこに引用されている文献、European J. Org. Chem. 2002 (13), pp. 2094-2108, Tetrahedron 2001, 57 (27) pp. 5885-5895、Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 2000, 10(8), pp. 835-838およびSynthesis 2000 (1), pp. 103-108)に記載されている。その反応は一般的に、例えばエーテル(ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチルtert-ブチルエーテルまたはテトラヒドロフランなど)、ハロ炭化水素

40

50

(塩化メチレンなど)、脂肪族もしくは脂環式炭化水素(ペンタン、ヘキサンまたはシクロヘキサンなど)または芳香族炭化水素(トルエン、キシレン、クメンなど)などの不活性溶媒中または上記溶媒の混合物中で行う。C1-SO<sub>2</sub>-Arとの反応は一般的に、補助塩基の存在下で行う。好適な塩基は、炭酸ナトリウムまたは炭酸カリウムまたは炭酸水素ナトリウムまたは炭酸水素カリウムなどの無機塩基、ならびに例えばトリエチルアミンなどのトリアルキルアミン類またはピリジン、ルチジンなどのピリジン化合物などの有機塩基である。後者の化合物は、同時に溶媒として用いることができる。補助塩基は一般的に、アミン化合物(II-1)に基づいて少なくとも等モル量で使用する。

#### 【0110】

スルホニル化反応に先立って、基NH<sub>2</sub>をNR<sup>5</sup>基に変換することができ、R<sup>5</sup>はR5において具体的に記載した水素とは異なる意味を有する(図式1には示していない)。

10

#### 【0111】

得られるスルホンアミド(III-1)において、Rが所望の基R<sup>1</sup>ではなく、その前駆体である場合、その化合物を下記に示した方法に従って修飾して、所望の置換基R<sup>1</sup>を得ることができる。前駆体は、容易に脱離可能で、所望の基R<sup>1</sup>によって置き換えることができ、または修飾してR<sup>1</sup>を与えることができる基である。その前駆体は、N-保護基であることもできる。

#### 【0112】

Rがアリルである場合、そのアリル基を開裂させて、Rが水素である化合物を得ることができる。アリル基の開裂は、触媒量のパラジウム(0)化合物または反応条件下でパラジウム(0)化合物を形成することができるパラジウム化合物(例えば、二塩化パラジウム、テトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)またはトリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0))の存在下に、有利にはトリアリールホスフィン類(トリフェニルホスフィンなど)、トリアルキルホスフィン類(トリブチルホスフィンなど)およびシクロアルキルホスフィン類(トリシクロヘキシルホスフィンなど)などのホスフィン配位子と、特に2,2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフチルまたは1,4'-ビス(ジフェニルホスフィノ)ブタンなどのホスフィンキレート配位子と組み合わせて、文献から公知の方法(メルカプト安息香酸存在下でのN-アリルの脱離に関しては、WO94/24088参照; 1,3-ジメチルバルビツール酸存在下での脱離に関しては、J. Am. Chem. Soc. 2001, 123(28), pp. 6801-6808およびJ. Org. Chem 2002, 67(11) pp. 3718-3723参照。)を用いて、例えば化合物(III-1)[R=アリル]をメルカプト安息香酸または1,3-ジメチルバルビツール酸などのアリル捕捉剤と反応させることで行う。あるいは、N-アリルの開裂は、文献で公知の方法を用いて(J. Chem. Soc, Perkin Transaction I: Organic and Bio-Organic Chemistry 1999(21) pp. 3089-3104およびTetrahedron Asymmetry 1997, 8(20), pp. 3387-3391参照)、トリス(トリフェニルホスフィン)クロロロジウム(I)などのロジウム化合物の存在下に反応させることで行うこともできる。

20

30

#### 【0113】

Rがベンジルである場合、この置換基を開裂させて、RがHである化合物(III-1)を得ることもできる。その開裂の反応条件は、当業界では公知である。代表的には、ベンジル基は、Pd/炭素または水酸化パラジウムなどの好適なPd触媒の存在下での水素化反応によって脱離される。

40

#### 【0114】

Rは保護基であることもできる。その保護基を脱離させて、RがHである化合物(III-1)を得ることができる。好適な保護基は当業界で公知であり、例えばtert-ブトキシカルボニル(boc)、ベンジルオキシカルボニル(Cbz)、9-フルオレニルメトキシカルボニル(Fmoc)、トリフェニルメチル(Trt)およびニトロベンゼンスルフェニル(Nps)から選択される。好ましい保護基はbocである。その保護基は、酸(例えば、HClもしくはHBrなどのハロゲン酸またはトリフルオロ酢酸)によ

50

る、または場合により Pd 触媒存在下での水素化による保護アミンの処理などの公知の方法によって脱離させることができる。

【0115】

得られた R が H である化合物を次に、アルキル化の意味において、公知の方法で、化合物 R<sup>1</sup> - X と反応させることができる。この化合物において、R<sup>1</sup> は C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルまたは C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルであり、X は求核的に置き換えることができる脱離基、例えばハロゲン、トリフルオロ酢酸エステル、アルキルスルホン酸エステル、アリールスルホン酸エステル、アルキル硫酸エステルなどである。そのアルキル化に必要とされる反応条件については、十分に開示されている（例えば、Bioorganic and Medicinal Chemistry Lett. 2002, 12(7), pp. 2443-2446 および 2002, 12(5), pp. 1917-1919 で）。

10

【0116】

そのアルキル化は、還元的アミノ化の意味において、還元剤の存在下、例えば水素化ホウ素 ナトリウム、水素化シアノホウ素ナトリウムまたは水素化ホウ素トリアセトキシナトリウムなどのホウ化水素化合物の存在下に、R = H である化合物 (I - 1) を好適なケトンまたはアルデヒドと反応させることで行うこともできる。当業者であれば、還元的アミノ化に要求される反応条件については熟知している（例えば、Bioorganic and Medicinal Chemistry Lett. 2002, 12(5), pp. 795-798 and 12(7) pp. 1269-1273 から）。

20

【0117】

R が水素である場合、得られるスルホンアミド (I - 1) はさらに、アシルハライドと反応させて、R<sup>1</sup> が C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - アルキルカルボニルである式 I の化合物を得ることができる。これらの化合物におけるカルボニル基をジボランで還元して、R<sup>1</sup> が C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub> - アルキルである一般式 I の化合物を得ることができる。そのカルボニル基は、フッ素化剤と反応させて、R<sup>1</sup> が 1, 1 - ジフルオロアルキルである化合物 I を得ることもできる。アシル化および還元は標準的な方法によって行うことができ、それは文献に記載されている（Jerry March, Advanced Organic Chemistry, 3rd ed. J. Wiley & Sons, New York 1985, p.370 and 373 (アシル化) および p. 1099 f., ならびにこの刊行物で引用されている文献 (アシル化に関しては、Synth. Commun. 1986, 16, p. 267 も参照し、還元に関しては J. Heterocycl. Chem. 1979, 16, p. 1525 も参照する。 ) ) 。

30

【0118】

経路 B

経路 B では、プロモ置換化合物 (II - 2) を、適切なスルホンアミド ArSO<sub>2</sub>NH R<sup>5</sup> と反応させて、スルホンアミド (I - 1) を得る。その反応は通常、例えばマイクロ波条件下のような活性化条件下で行う。カップリングには、Pd、特に Pd(0) または Cu 触媒を用いることもできる（例えば、Org. Lett. 2000, 2, 1101; J. Am. Chem. Soc. 2002, 124, 6043; Org. Lett. 2003, 5, 4373; Tetrahedron Lett. 2003, 44, 338 5 参照）。好適な Pd(0) 触媒の例は、テトラキス(トリフェニルホスフィン) - パラジウム(0) および Pd<sub>2</sub>(dba)<sub>3</sub> (トリス(ジベンジリデンアセトン) - ジパラジウム(0)) であり、それらは一般的に、例えばトリフェニルホスフィン、トリトリルホスフィンもしくはキサントホスなどのトリアリールホスフィン、トリス - n - ブチルホスフィン、トリス(tert - ブチル)ホスフィンもしくはトリス(シクロヘキシルホスフィン)などのトリ(シクロ)アルキルホスフィンなどのトリ(置換)ホスフィンの存在下に用いられる。この経路は、相当するスルホニルクロライドが入手できない場合に特に有用である。

40

【0119】

あるいは、プロモ置換基は、例えば、文献（例えば、J. Org. Chem., 68 (2993) pp 82 74-8276 または J. Org. Chem. 2000, 65, 2612）に記載の方法に従って、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0) などのパラジウム(0) 化合物の存在下に、例えばトリフェニル - ホスフィンもしくはトリトリルホスフィンなどのトリアリールホスフィ

50

ン、トリス - n - ブチルホスフィン、トリス ( t e r t - ブチル ) ホスフィンもしくはトリス ( シクロヘキシルホスフィン ) などのトリ ( シクロ ) アルキルホスフィンなどのトリ ( 置換 ) ホスフィンの存在下に、好ましくは水素化ナトリウムなどの塩基の存在下に、ベンゾフェノンイミンまたはリチウムビス ( トリメチルシリル ) アミドと反応させることでアミノ置換基によって置き換えることができる。得られたアミノ化合物について次に、経路 A のスルホン化反応を行うことができる。

【 0 1 2 0 】

経路 C

経路 C では、化合物 ( I I - 3 ) を、水素化ナトリウムまたはナトリウムアルコキシドなどの塩基の存在下にメルカプト化合物 H S - A r と、またはそのアルカリ金属塩と反応させることで、チオエーテル化合物を得る。次に、チオエーテル部分を、例えばオキソンによって酸化することでスルホン部分として、スルホン ( I - 2 ) を得る。

10

【 0 1 2 1 】

置換基 A r は、各種スルホニルクロライドを用いることで、あるいは公知の方法によってスルホンアミド ( I - 1 ) またはスルホン ( I - 2 ) を形成した後に基 A r の置換基を修飾することで変化させることができる。例えば、A r 基の臭素置換基は、文献 ( Tetrahedron Asym. 1999, 10, 1831 ) に記載の基準に従って N 結合ピロリジニル基によって置き換えることができる。この P d 介在カップリングは、アゼチジニル、ピラゾリジニル、イミダゾリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニルなどの全ての窒素含有複素環に適用可能である。その反応は、ハロゲン、アルキルまたはフッ素化アルキルなどの 1 以上の置換基を有する複素環化合物にも適用可能である。A r 基の臭素置換基はさらに、プロモ化合物を、例えばテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム ( 0 ) などの適切な P d カップリング触媒の存在下にスズ酸アルケニルトリブチルと反応させるスティルカップリングに従ってイソプロペニル基によって置き換えることができる ( 例えば、Tetrahedron, 2003, 59(34), 6545 および Bioorg. Med. Chem. 1999, 7(5), 665 参照。 )。イソプロペニル基は次に、公知の水素化法によってイソプロピル基に変換することができる。

20

【 0 1 2 2 】

式 ( I I ) ( I I - 1、I I - 2 および I I - 3 ) の化合物は、下記に示した方法に従って合成することができる。

30

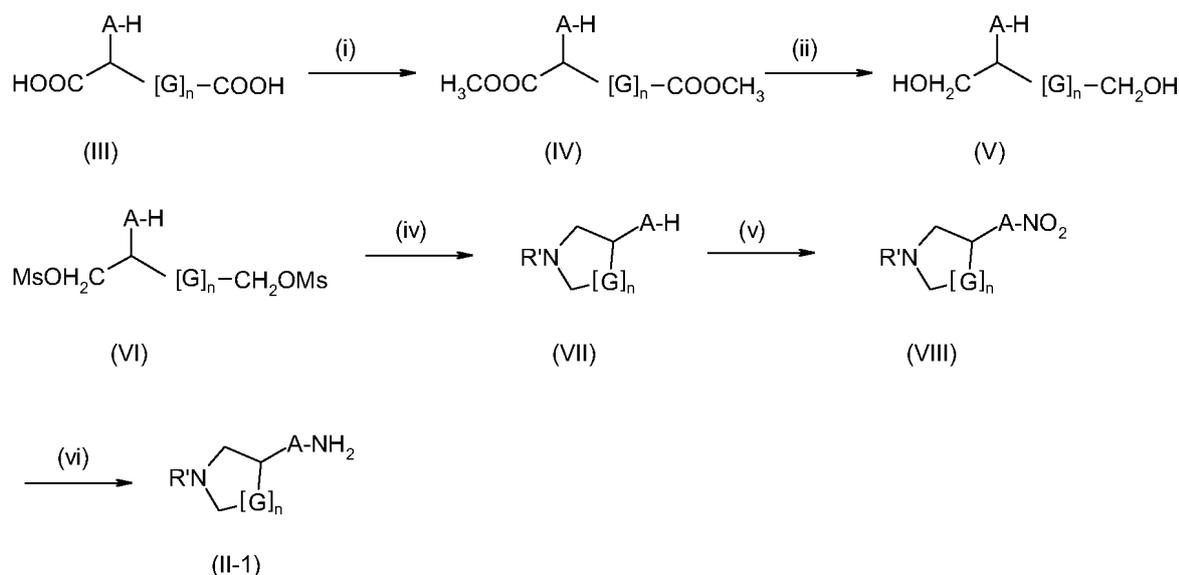
【 0 1 2 3 】

1 . D が基 B である化合物 ( I I - 1 ) の合成

【 0 1 2 4 】

## 【化 1 1】

図式 2



10

## 【 0 1 2 5】

図式 2 において、A、G、n および R は上記で定義の通りである。

20

## 【 0 1 2 6】

酸 ( I I I ) のそのメチルエステル ( I V ) への変換は、例えばマーチの著作 ( Jerry March, Advanced Organic Chemistry, John Wiley, 3<sup>rd</sup> edition, page 348ff ) に記載の方法に従い、標準的な技術によって行う。例えば、酸を  $\text{SOCl}_2$  と反応させる等により、相当する酸塩化物に変換する。次に、その塩化物をメタノールとの反応によってエステルに変換する。

## 【 0 1 2 7】

段階 ( i i ) での還元は好適には、カルボン酸エステルのアルコールへの変換についての標準的な条件下で行う。適切な反応条件および還元剤については、例えばマーチの著作 ( Jerry March, Advanced Organic Chemistry, John Wiley, 3<sup>rd</sup> edition, page 1093ff ) に記載されている。代表的な還元剤は、金属水素化物および複合水素化物である。好適な金属水素化物の例には、好適にはテトラヒドロフランおよびジエチルエーテルなどの錯形成性溶媒の存在下での  $\text{BH}_3$ 、9-BBN、 $\text{AlH}_3$  および  $\text{AlH}(\text{i-Bu})_2$  ( DIBAL-H ) などがある。複合水素化物は、例えば  $\text{NaBH}_4$ 、 $\text{LiAlH}_4$  および  $\text{LiAlH}(\text{OR})_3$  であり、R はメチル、エチル、イソブチルまたは tert-ブチルなどの  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -アルキルである。好ましい還元剤は  $\text{LiAlH}_4$  である。その還元は好適には、鎖状および環状エーテル ( 例：テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジブチルエーテルおよびメチルブチルエーテル ) などの錯形成溶媒中で行う。好ましい溶媒はテトラヒドロフランである。

30

## 【 0 1 2 8】

メシル化段階 ( i i i ) では、アルコール官能基を、より良好な脱離基に変換する。そのメシル化は、標準的な条件下で、例えば塩基の存在下にアルコールをメタンスルホンクロライドと反応させることで行う。好適な塩基は特に、ジエチルアミン、トリエチルアミンおよびエチルジイソプロピルアミンなどのアルキルアミン類である。この段階では、トリフルオロ酢酸エステル、他のアルキルスルホン酸エステル、アリールスルホン酸エステル ( 例：トシル酸エステル )、アルキル硫酸エステルおよび同様のトシル酸エステルなどの良好な脱離基を代表する他の官能基を、メタンスルホニル基に代えて導入することができる。

40

## 【 0 1 2 9】

環化段階 ( i v ) では、化合物 ( V I ) またはその好適な誘導体を、1級アミン  $\text{NH}$

50

$R^2$  と反応させる。1級アミンが液体である場合、それは溶媒としても用いることができ、それ以上の溶媒は必要ない。アミンが粘稠性であるか固体である場合、その反応は有利には、好適な溶媒中で行う。

#### 【0130】

段階(v)の反応は、芳香族基上でのニトロ化反応について一般的な反応条件下で行い、それについては文献に記載されている(例えば、Jerry March, *Advanced Organic Chemistry*, John Wiley, 3<sup>rd</sup> edition, page 468ff, Tetrahedron 1999, 55(33), pp. 10243-10252, *J. Med. Chem.* 1997, 40(22), pp. 3679-3686 and *Synthetic Communications*, 1993, 23(5), pp. 591-599)。例えば、化合物(VII)を、濃硫酸存在下に濃硝酸または硝酸カリウムもしくはナトリウムなどの硝酸塩と反応させる。得られた生成物(VII)は、異なる位置異性体の形態であることができる(例えば、Aがフェニルまたは6員ヘタリールの場合にはオルト、メタまたはパラ)。Aがフェニルまたは6員ヘタリールの場合には、パラニトロ化合物が支配的であるのが一般的である。しかしながら、少量のオルト生成物も得られる可能性があり、メタ生成物は全く生成しないか、無視できる量でのみ生成する。オルト生成物およびパラ生成物を分離することで、Aが1,4-結合フェニルである式Iの化合物を、図式2に示した反応経路によって得ることができる。

10

#### 【0131】

段階(vi)では、(VII)におけるニトロ基を還元して $NH_2$ 基とする。次に、 $NH_2$ 基を、 $R^5$ に関して具体的に挙げた水素以外の意味を有する。)に変換することができる。段階(vi)に必要な反応条件は、芳香族ニトロ基の還元についての一般的な条件に相当し、それについては、文献に詳細に記載されている(例えば、J. March, *Advanced Organic Chemistry*, 3rd ed., J. Wiley & Sons, New-York, 1985, p. 1183およびこの参考文献で引用の文献を参照)。その還元は、例えば酸性反応条件下で鉄、亜鉛またはスズなどの金属とニトロ化合物VIIを反応させることで、すなわち発生期水素を用いるか、または好ましくは $NiCl_2(P(フェニル)_3)_2$ または $CoCl_2$ などのニッケルまたはコバルトの遷移金属化合物存在下に水素化リチウムアルミニウムまたは水素化ホウ素ナトリウムなどの複合水素化物を用いて(Ono et al. *Chem. Ind. (London)*, 1983 p.480参照。)または $NaBH_2S_3$ (Lalancette et al. *Can. J. Chem.* 49, 1971, p. 2990参照)を用いて行い、これらの還元は、所定の試薬に応じて、物質中または溶媒もしくは希釈剤中にて行うことができる。あるいは、その還元は、遷移金属触媒の存在下に水素で、例えば白金、パラジウム、ニッケル、ルテニウムまたはロジウム系の触媒の存在下に水素を用いて行うことができる。その触媒は、遷移金属を元素の形で、または遷移金属の錯化合物、塩もしくは酸化物の形態で含むことができ、活性を変える目的で、トリフェニルホスフィン、トリシクロヘキシルホスフィンまたはトリ-n-ブチルホスフィン類などの有機ホスフィン化合物またはホスファイト類のような一般的な共配位子を用いることが可能である。触媒は従来のように、触媒金属として計算して、ニトロ化合物1モル当たり0.001-1モルの量で用いる。好ましい変形態様では、その還元は、文献(*Biorganic and Medicinal Chemistry Letters*, 2002, 12(15), pp. 1917-1919 and *J. Med. Chem.* 2002, 45(21), pp. 4679-4688)に記載の方法と同様にして塩化スズ(II)を用いて行う。VIIの塩化スズ(II)との反応は好ましくは、不活性有機溶媒中、好ましくはメタノール、エタノール、イソプロパノールまたはブタノールなどのアルコール中で行う。

20

30

40

#### 【0132】

当業者であれば、図式2に記載の合成が、例えば相応に置換された化合物(III)を原料とすることによる化合物(II)の製造と結果的に化合物(I)( $R^2$ 、 $R^3$ および $R^4$ はH以外である。)の製造の製造にも好適であることは明らかであろう。相当するエナンチオマー(III)を原料とすることで合成可能なエナンチオマー的に純粋な(I)の合成に、同じことが当てはまる。

#### 【0133】

##### 2. 化合物(II-2)の合成

50

式 ( I I - 2 ) の化合物は、図式 2 の段階 ( v ) でニトロ化に代えてハロゲン化を行うことで合成することができる。ピリジル基のハロゲン化反応は、広く用いられる標準的な方法であり、例えばマーチの著作 ( Jerry March, Advanced Organic Chemistry, John Wiley, 3<sup>rd</sup> edition page 476 ff ) に記載されている。

【 0 1 3 4 】

### 3 . 化合物 ( I I - 3 ) の合成

これら化合物の合成も、標準的な反応方法に属するものであり、メチル置換ピリジル化合物のメチル基をモノハロゲン化することで行うことができる。

【 0 1 3 5 】

### 4 . エナンチオマー的に純粋な化合物 I の合成

項目 1 に記載の方法に加えて、エナンチオマー的に純粋な化合物 ( I ) は、その好適な前駆体に標準的な分割技術を適用することで得ることもできる。例えば、化合物 V I I I ( 上記の図式 2 を参照 ) または化合物 ( I I - 2 ) もしくは ( I I - 3 ) ( 上記の図式 1 参照 ) ( R は、ベンジルなどの好適な保護基である。 ) を、酒石酸またはその誘導体 ( 例 : 酒石酸ジエチル、酒石酸ジプロピル、酒石酸ジイソプロピルなど ) と反応させて、2 種類のジアステレオマー塩を得ることができる。これらは、一般的な方法で、例えば抽出もしくはクロマトグラフィー法によって、または好ましくは分別結晶によって分離することができる。そうして分離されたジアステレオマー塩を次に、その塩を好適な塩基と反応させて化合物 V I I I、I I - 2 または I I - 3 の S - もしくは R - エナンチオマーを得ることで、エナンチオマー的に純粋な化合物 V I I I、I I - 2 または I I - 3 に変換する。好適な塩基は、例えば水酸化カリウムおよび水酸化ナトリウムなどのアルカリ金属水酸化物、水酸化マグネシウムおよび水酸化カルシウムなどのアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウムおよび炭酸カリウムなどのアルカリ金属炭酸塩、炭酸マグネシウムおよび炭酸カルシウムなどのアルカリ土類金属炭酸塩、酸化ナトリウムおよび酸化カリウムなどのアルカリ金属酸化物、および酸化マグネシウムおよび酸化カルシウムなどのアルカリ土類金属酸化物 ; 例えばナトリウムメタノレート、ナトリウムエタノレートまたはナトリウム - t e r t - ブタノレートのようなアルコレート類、ジメチルアミン、トリメチルアミン、ジエチルアミン、トリエチルアミン、ジプロピルアミン、トリプロピルアミン、ジイソプロピルアミン、ジイソプロピルエチルアミンなどのアミン類およびピリジン、ピコリンおよびルチジンなどの窒素含有塩基性複素環化合物などの有機塩基である。

【 0 1 3 6 】

### 5 . 具体的な合成

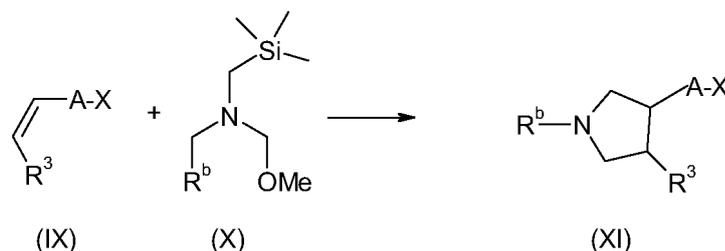
5 . 1 : D が基 B であり、n が 1 である化合物 I ( ピロリジニルスルホニル誘導体 ) およびその前駆体の合成

#### 5 . 1 . 1

【 0 1 3 7 】

【 化 1 2 】

図式 3:



【 0 1 3 8 】

図式 3 において、A および R<sup>3</sup> は上記で定義の通りである。

【 0 1 3 9 】

10

20

30

40

50

ピロリジン環は、非安定化アゾメチンイリドのアルケニルピリジン誘導体 (IX) (例えば、2 -、3 - もしくは 4 - ビニルピリジン、 $R^3 = H$ ) への [3 + 2] 双極性環状付加によっても入手可能である。この手順は、文献に記載されている (J. Org. Chem 1987, 52, 235)。イリドの前駆体であるアミン  $N(CH_2 R^b)$  ( $CH_2 Si Me_3$ ) ( $CH_2 OCH_3$ ) (X) は市販されているか、メタノールの存在下に  $NH_2(CH_2 R^b)$ 、 $Me_3 Si CH_2 Cl$  および  $HCHO$  から合成することが可能である。

【0140】

アルケニルピリジン化合物 (IX) は、例えばテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム (0) のような適切な Pd カップリング触媒の存在下に、例えばプロモピリジン (2 -、3 - もしくは 4 - プロモピリジン) などのハロゲノピリジンのスズ酸ビニルもしくはイソブテニルトリブチルなどの相当するスズ酸アルケニルトリブチルとのスティルカップリングによって合成することができる (例えば、Tetrahedron, 2003, 59(34), 6545 and Bioorg. Med. Chem. 1999, 7(5), 665 参照)。特別なスティル異性体 (例: シス - もしくはトランス - スズ酸イソブテニルトリブチル) を選択することで、相当するシス - もしくはトランスアルキルピリジルピロリジンを選択的に製造することができる。

10

【0141】

あるいは、アルケニルピリジン化合物 (IX) は、相当するピリジルアルデヒドと  $PPH_3 = CHR$  (R は H または  $C_1 - C_3$  - アルキルである。) などのウィティッヒ試薬とのウィティッヒ反応によって合成することができる。ウィティッヒ反応の条件は当業界で公知であり、例えばマーチの著作 (Jerry March, Advanced Organic Chemistry, John Wiley, 3<sup>rd</sup> edition, page 845 ff) に記載されている。

20

【0142】

有利には、アルケニルピリジン化合物 (IX) はさらに、好ましくは適切な位置にニトロ基または別のハロゲノ置換基 ( $X = NO_2$  またはハロゲン) を有する (2 - アルケニルピリジンは好ましくは 4 位もしくは 6 位で X によって置換されており、3 - アルケニルピリジンは好ましくは 3 位で X によって置換されており、4 - アルケニルピリジンは好ましくは 2 位で X によって置換されている。) の場合、次の反応段階は経路 A または B に示した方法で行うことができる。X = H の場合、最初に図式 2 段階 (v) に記載の方法で A 環をニトロ化し、次に図式 2 段階 (vi) および図式 1 経路 A の反応を行うことができ、または環 A をハロゲン化し、次に経路 B の手順を行うことができる。

30

【0143】

前駆体アミンの基  $CH_2 R^b$  は有利には、最終化合物 I の所望の基  $R^1$  に相当するか、脱離させて N 非置換ピロリジンを与えることができるベンジルなどの開裂可能な基である。次に、後者を上記の方法に従って官能化することができる (経路 A 参照)。

【0144】

ピリジルピロリジン類の合成は、文献に記載されている (例えば、Chem. Pharm. Bull., 1985, 33, 2762-66; J. Heterocyclic Chemistry, 1996, 1995-2005; J. Heterocyclic Chemistry, 2001, 38, 1039-1044; Tetrahedron Letters, 1992, 33, 44, 6607-10; Heterocycles, 1998, 48, 12, 2535-2541)。

40

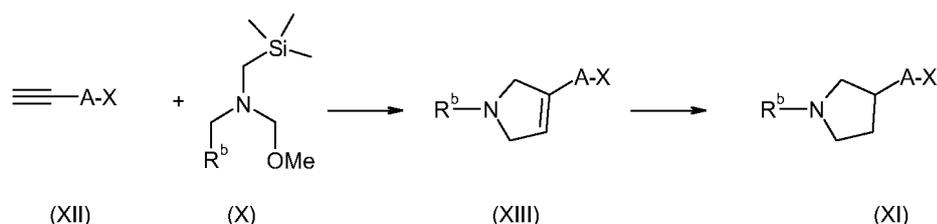
【0145】

5.1.2

【0146】

## 【化 1 3】

図式 4:



10

## 【 0 1 4 7】

ピリジルピロリジン類は、非安定化アゾメチンイリドの1-アルキニルベンゼン(X I)への[3+2]双極性環状付加によっても入手可能である(例えば、Tetrahedron 1996, 52, 59と同様に)。次に、得られたピロリン(X I I I)または最終生成物(I)を水素化して、相当するピロリジン(X I)とする。水素化を、例えばキラル触媒を用いることでキラル条件下で行うと、エナンチオマー的に純粋なピリジルピロリジン化合物を得ることができる。キラル水素化触媒は当業界で公知である。それに続く所望のスルホンアミドへの変換は、経路AまたはBに記載の方法に従って行うことができる。

## 【 0 1 4 8】

## 5 . 1 . 3

20

あるいは、ピリジルピロリジン化合物は、有機亜鉛ピロリジン化合物とのPd介在交差カップリングを行ってピリジルハライドから製造することができる。この方法については、経路Fで下記にてさらに詳細に説明する。この代替法でも、ピリジルハライドは有利にはニトロ基を有する。この場合、所望のスルホンアミドへの変換は、経路Aに記載の方法に従って行うことができる。あるいは、ピリジルハライドがハロゲン原子を有する。その場合、所望のスルホンアミドへの変換を、経路Bに記載の方法に従って行うことができる。

## 【 0 1 4 9】

## 5 . 1 . 4

30

ピリジルピロリジンは、代表的なヘック条件下で保護ピロリンを所望のピリジン(例: 2-ヨード-4-ニトロピリジン、2-ヨード-6-ニトロピリジンまたは3-ヨード-5-ニトロピリジン)と反応させるヘック反応によって製造することができる。ピロリン二重結合の接触水素化および図式2に記載の手順によるニトロ基の還元により、所望の生成物が得られる。

## 【 0 1 5 0】

N-保護ピロリンは、市販のピロリンを例えばフマル酸クロロメチル、ベンジルクロライド、Cbz-無水物またはBoc-無水物などの所望の保護基と反応させることで得ることができる。

## 【 0 1 5 1】

ピロリンは、グラブス触媒などのメタセシス触媒の存在下でのN-保護ジアリルアミンのメタセシス反応で合成することができる。

40

## 【 0 1 5 2】

## 5 . 1 . 5

ピリジルピロリジンはさらに、N-保護3-オキソピロリジンを金属化ニトロピリジンと反応させ、得られたアルコールを脱水し、ピロリン環の二重結合を水素化することで製造することができる。金属化ニトロピリジンは、グリニャル反応またはリチウム化に関する標準的な条件下で、ハロニトロピリジン(例: 2-プロモ-4-ニトロピリジンまたは4-プロモ-2-ニトロピリジンまたは3-プロモ-5-ニトロピリジン)をMgBr<sub>2</sub>または好ましくはn-ブチルリチウムと反応させることで得ることができる。N-保護3-オキソピロリジンは、市販の3-オキソピロリジンを例えばフマル酸クロロメチル、ベ

50

ンジルクロライド、アリルクロライド、C b z - 無水物またはB o c - 無水物などの所望の保護基と反応させることで得ることができる。

【 0 1 5 3 】

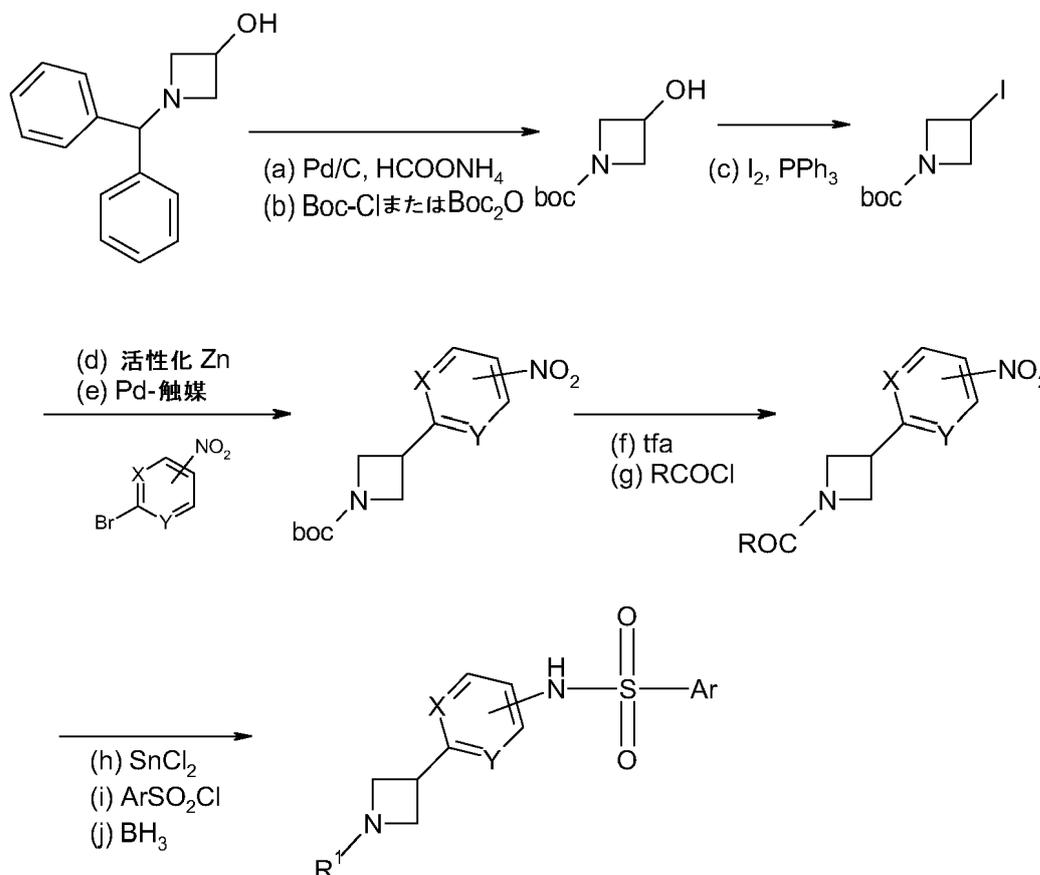
5 . 2 : D が基 B であり、n が 0 である化合物 I ( N - ( アゼチジン - 3 - イル ) - スルホンアミド類 ) およびその前駆体の合成

n が 0 である化合物 I ( アゼチジン化合物 ) は下記の方法に従って合成することができる。

【 0 1 5 4 】

【 化 1 4 】

図式 5:



10

20

30

【 0 1 5 5 】

図式 5 において、Ar および R<sup>1</sup> は上記で定義の通りである。X および Y は互いに独立に CH または N である。

【 0 1 5 6 】

1 - ベンズヒドリル - アゼチジン - 3 - オールを原料とし、アミンの Pd 介在脱保護 (Tetrahedron 2002, 58, 9865-9870)、カーバメート形成とそれに続くハロゲン化によって、中間体を得て、それについて Zn 挿入を行う (Tetrahedron 1987, 43, 2203-2212; J. Org. Chem. 1988, 53, 2390-2392)。そうして得られた有機亜鉛種を、適切な 2 - ハロニトロ環と反応させて (Synlett 1998, 4, 379-380; J. Am. Chem. Soc. 2003, 125, 12527-12530)、ニトロ - アリール - アゼチジン核を得ることができる。2 - ハロ - ハロ - 環を用いる場合は、アリール - アゼチジンハライドと適切なスルホンアミドとの間の直接カップリングを行うことも可能である (Org. Lett. 2000, 2, 1101-1104; J. Am. Chem. Soc. 2002, 124, 6043-6048; Org. Lett. 2003, 5, 4373-4376; Tetrahedron Lett. 2003, 44, 3385-3386)。そのアミンは、カーバメートの開裂 (例えば、Boc カーバメートの場合はトリフルオロ酢酸を使用) によって再生させることができ、次に適切なアシルクロライドとの反応によってアミドに変換することができる。ニトロ基は、塩化スズまた

40

50

は接触水素化（例：Pd-C）を介して還元してアミンとすることができ、次にピリジンなどの塩基の存在下に適切なスルホニルクロライドと反応させることで所望のスルホンアミドに変換することができる。ハイドロボレーションによるアミドの最終的な還元によって、最終化合物が得られる。

【0157】

当然のことながら、前記反応は、アゼチジン基に結合した（ヘテロ）芳香族環が5員複素環基（例：チエニル）である化合物にも適用される。

【0158】

5.3: Dが基Bであり、nが2である化合物I（N-（ピペリジン-3-イル）-スルホンアミド類）およびその前駆体の合成

上記の合成（経路A、BおよびC）に加えて、市販の3-アリアルまたは3-ヘタリールピペリジンを原料とすることで、nが2であり、EがNR<sup>5</sup>（ピペリジン-3-イルスルホンアミド）である化合物Iを製造することができる。次に、これらの原料化合物をアミノ置換またはハロゲン化誘導体に変換し、次に経路AおよびBの合成経路を行うことができる。

【0159】

5.4: Dが基Cである化合物I（N-（ピペラジン-4-イル）-スルホンアミド類）およびその前駆体の合成

ピペラジニルピリジン化合物Iは、N-モノ保護ピペラジンのハロニトロピリジンへの、例えば3-プロモ-5-ニトロピリジン、3-プロモ-2-メトキシ-5-ニトロピリジン、2-プロモ-4-ニトロピリジン、4-プロモ-2-ニトロピリジンまたは4-プロモ-5-メトキシ-2-ニトロピリジンへのPd介在カップリングによる、相当するピペラジニル置換ニトロピリジンの取得と、ニトロ基の還元および図式Aに従ったスルホン化によって製造することができる。

【0160】

好適なN-保護基は上記のものである。

【0161】

当業者であれば、官能基相互変換によって、構造的に類似した化合物から式Iの化合物を得ることもできることは容易に理解するものである。特に、相当するハロゲン化合物、すなわちR<sup>a</sup>に代えてハロゲン原子、特に臭素もしくはヨウ素原子を有する式Iの化合物を、塩基の存在下に、好ましくはブッフバルト・ハートウィッグ反応に関してのパラジウム触媒も存在させて、1級または2級アミンと反応させることで、N結合基R<sup>a</sup>を式Iの化合物に導入することができる。

【0162】

別段の断りがなければ、上記の反応は室温から使用溶媒の沸点との間の温度で溶媒中に行う。あるいは、マイクロ波を用いて反応混合物に反応に必要な活性化エネルギーを導入することができる、その何らかが、特に、遷移金属によって触媒される反応の場合には（マイクロ波を用いる反応に関しては、Tetrahedron 2001, 57, p. 9199 ff. p. 9225 ffを参照し、一般法では Microwaves in Organic Synthesis , Andre Loupy (Ed.), Wiley-VCH 2002を参照する。）有効であることが明らかになっている。

【0163】

スルホニルクロライドCl-SO<sub>2</sub>-Arは市販されているか、標準的な合成方法に従って製造することができる。フッ素化基R<sup>a</sup>を含むスルホニルクロライドは、好適なヒドロキシまたはオキソ前駆体（例：ヒドロキシ基またはオキソ置換基を有する化合物Cl-SO<sub>2</sub>-Ar）をDAST（ジエチルアミノ硫黄トリフルオリド）、モルホリン-DAST、デオキソ-フルオル（ビス（2-メトキシエチル）アミノ硫黄トリフルオリド）、イシカワ試薬（N,N-ジエチル-（1,1,2,3,3,3-ヘキサフルオロプロピル）アミン；Journal of Fluorine Chemistry, 1989, 43, 371-377）などのフッ素化試薬と反応させる等の各種合成経路によって製造することができる。より簡便には、ヒドロキシ置換基を有するがクロロスルホニル基は持たない芳香族化合物のヒドロキシ基を脱離基に変

10

20

30

40

50

換し、次にそれをフッ素化物イオンによって置き換える (J. Org. Chem., 1994, 59, 289 8-22901 ; Tetrahedron Letters, 1998, 7305-6; J. Org. Chem., 1998, 63, 9587-9589, Synthesis, 1987, 920-21)。次に行うクロロスルホン酸による直接クロロスルホニル化 (Heterocycles, 2001, 55, 9, 1789-1803 ; J. Org. Chem., 2000, 65, 1399-1406) または最初にスルホン酸誘導体を製造し、次にそれを例えばクロロスルホン酸、五塩化リンなどでスルホニルクロライドに変換する 2 段階法 (Eur. J. Med. Chem., 2002, 36, 809-828) などによって、所望のスルホニルクロライドを得る (Tetrahedron Letters, 1991, 33, 50 7787-7788)。スルホニルクロライドは、酸性条件下での好適なアミン前駆体  $Ar-NH_2$  の亜硝酸ナトリウムによるジアゾ化および酢酸中での二酸化硫黄との反応によって (図式 (iii) ; J. Org. Chem., 1960, 25, 1824-26) ; 好適なヘテロアリール - チオール  $HS-Ar$  またはヘテロアリール - ベンジル - チオエーテル  $C_6H_5-CH_2-S-Ar$  を塩素で酸化して (Synthesis, 1998, 36-38; J. Am. Chem. Soc, 1950, 74, 4890-92)、直接相当するスルホニルクロライドとすることで製造することもできる。さらに別のものが当業界で知られており、標準的な方法によって製造することができる。

10

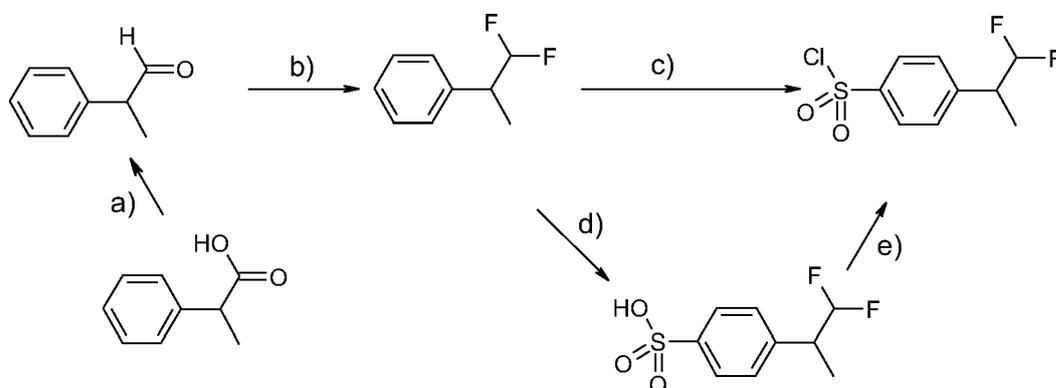
## 【 0 1 6 4 】

下記の図式 6 から 8 では、フッ素化プロピル基を有するベンゼンスルホニルクロライドを製造する上で好適ないくつかの経路を示してある。

## 【 0 1 6 5 】

## 【 化 1 5 】

図式 6:



20

30

## 【 0 1 6 6 】

4 - (1, 1 - ジフルオロプロパン - 2 - イル) ベンゼン - 1 - スルホニルクロライド 中間体は、市販の 2 - フェニルプロパン酸から製造することができる。最初の段階 a) では、2 - フェニルプロパン酸を酸触媒作用 (例えば、 $HCl$ 、 $SO_2Cl_2$ ) 下にアルコール (例えば、メタノールまたはエタノール) でエステル化することで、アルキルエステルに変換する。そのエステルを、DIBAL (水素化ジイソブチルアルミニウム) などの還元剤によって相当する 2 - フェニルプロパノールに還元することができる。DAST (ジエチルアミノ硫黄トリフルオリド)、モルホリン - DAST、デオキソ - フルオル (ビス (2 - メトキシエチル) アミノ硫黄トリフルオリド)、イシカワ試薬 (N, N - ジエチル - (1, 1, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロピル) アミン; Journal of Fluorine Chemistry, 1989, 43, 371-377) などの好適なフッ素化試薬と反応させることで、アルデヒドを 1, 1 - ジフルオロ - 2 - プロピル誘導体に変換する (段階 b)。そうして得られた 1, 1 - ジフルオロ - 2 - フェニルプロパンを、クロロスルホン酸による直接クロロスルホニル化 (Heterocycles, 2001, 55, 9, 1789-1803 ; J. Org. Chem., 2000, 65, 1399-1406) (段階 c) または最初にスルホン酸誘導体を製造し (段階 d)、次にそれを例えばクロロスルホン酸、五塩化リンなどでスルホニルクロライドに変換する (段階 e) 2 段階法 (Eur. J. Med. Chem., 2002, 36, 809-828) によって; 酸性条件下での亜硝酸ナト

40

50

リウムによる好適なアミン前駆体のジアゾ化と、酢酸中での二酸化硫黄との反応によって (J. Org. Chem., 1960, 25, 1824-26) ; 好適なヘテロアリール - チオール類またはヘテロアリール - ベンジル - チオエーテル類の塩素による (Synthesis, 1998, 36-38 ; J. Am. Chem. Soc, 1950, 74, 4890-92) 相当するスルホニルクロライド類への直接酸化によって、4 - ( 1 , 1 - ジフルオロ - 2 - プロピル ) ベンゼンスルホニルクロライドに変換することができる。

【 0 1 6 7 】

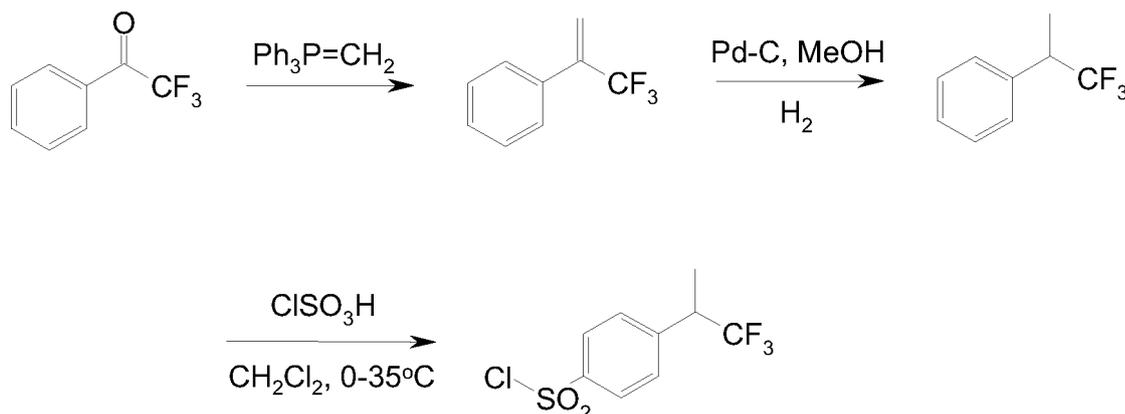
図式 6 に示した合成を、( R ) - 2 - フェニルプロパン酸および ( S ) - 2 - フェニルプロパン酸をそれぞれ用いて行って、相当するキラル 4 - ( 1 , 1 - ジフルオロプロパン - 2 - イル ) ベンゼン - 1 - スルホニルクロライドを得ることもできる。

10

【 0 1 6 8 】

【 化 1 6 】

図式 7:



20

【 0 1 6 9 】

4 - ( 1 , 1 , 1 - トリフルオロプロパン - 2 - イル ) ベンゼン - 1 - スルホニルクロライド中間体は、図式 7 に示した合成経路によって、市販の 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - フェニルエタノンから製造することができる。そのケトンをも、メチレン - トリフェニルホスファン (メチルトリフェニルホスホニウムハライドおよびリチウムジイソプロピルアミドまたはカリウム tert - ブトキシドなどの好適な塩基の反応によって製造) などの好適なイリドとのウィティッヒ反応によって、またはホーナー - エモンズ反応に従ってケトンを経由してジエチルメチルホスホネートなどの好適なホスホネートおよびリチウムジイソプロピルアミドまたはカリウム tert - ブトキシドなどの好適な塩基と反応させることで、3 , 3 , 3 - トリフルオロ - 2 - フェニルプロペンに変換することができる。そうして得られた 3 , 3 , 3 - トリフルオロ - 2 - フェニルプロペンを接触水素化 (例 : Pd - C) とそれに続く図式 6 に記載の方法によるスルホニルクロライドへの変換によって還元して、飽和アルカンとすることができる。

30

【 0 1 7 0 】

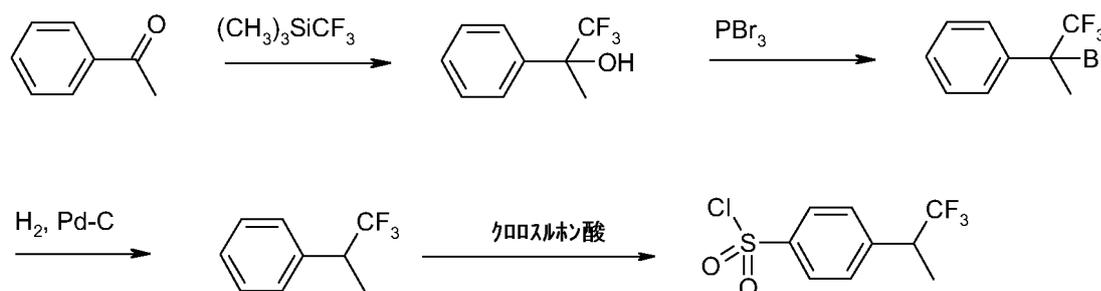
図式 7 の合成をアルケン水素化用のキラル触媒を用いて行って、相当するキラル 4 - ( 1 , 1 , 1 - トリフルオロプロパン - 2 - イル ) ベンゼン - 1 - スルホニルクロライドを製造することもできる。

40

【 0 1 7 1 】

## 【化 17】

図式 8:



10

## 【0172】

4 - ( 1 , 1 , 1 - トリフルオロプロパン - 2 - イル ) ベンゼン - 1 - スルホニルクロライドは、図式 8 に示した 4 段階手順によって、市販の 1 - フェニル - エタノンから製造することもできる。そのケトン、トリメチル - トリフルオロメチル - シランとの反応によってトリフルオロメチルヒドロキシル中間体に変換することができ ( Journal of Organic Chemistry, 2000, 65, 8848-8856 ; Journal of Fluorine Chemistry, 2003, 122, 243-246 )、それを次にトリフルオロメチルプロマイドに変換することができる ( Journal of the American Chemical Society, 1987, 109, 2435-4 )。接触水素化 ( 例 : P d - C ) による脱ハロゲンを行ってから、上記の方法によってスルホニルクロライドに変換することができる。

20

## 【0173】

使用可能な溶媒の例としては、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メチル tert - ブチルエーテルまたはテトラヒドロフランなどのエーテル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ジメトキシエタンおよびアセトニトリルなどの非プロトン性極性溶媒、トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素、アセトンまたはメチルエチルケトンなどのケトン類、塩化メチレン、トリクロロメタンおよびジクロロエタンなどのハロ炭化水素類、酢酸エチルおよび酪酸メチルなどのエステル類、酢酸またはプロピオン酸などのカルボン酸類、ならびにメタノール、エタノール、n - プロパノール、イソプロパノール、n - ブタノール、イソブタノール、2 - ブタノールおよび tert - ブタノールなどのアルコール類がある。

30

## 【0174】

所望に応じて、塩基を存在させて、反応で放出されるプロトン进行中和することが可能である。好適な塩基には、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウムまたは炭酸水素カリウムなどの無機塩基、さらにはナトリウムメトキシドまたはナトリウムエトキシドなどのアルコキシド類、水素化ナトリウムなどのアルカリ金属水素化物、さらにはブチリチウム化合物またはアルキルマグネシウム化合物などの有機金属化合物、またはトリエチルアミンまたはピリジンなどの有機窒素塩基などがある。後者の化合物は同時に、溶媒として用いることもできる。

40

## 【0175】

得られた粗生成物は、例えば濾過、溶媒留去または反応混合物からの抽出などの一般的な方法で単離される。得られた化合物は、一般的な方法で、例えば溶媒からの再結晶によって、クロマトグラフィーによって、または酸付加塩への変換によって精製することができる。

## 【0176】

化合物 I の酸付加塩は、適切な場合には、例えば低級アルコール ( メタノール、エタノールまたはプロパノールなど )、エーテル ( メチル tert - ブチルエーテルまたはジイソプロピルエーテルなど )、ケトン ( アセトンまたはメチルエチルケトンなど ) またはエステル ( 酢酸エチルなど ) の有機溶媒中の溶液での遊離塩基の相当する酸との混合によって、一般的な方法で製造される。

50

## 【0177】

式Iの本発明による化合物は、5HT<sub>6</sub>受容体に対して驚くほど高選択性を有する。式Iの化合物はさらに、D<sub>1</sub>受容体、D<sub>5</sub>受容体、D<sub>4</sub>受容体、1-アドレナリンおよび/または2-アドレナリン受容体、ムスカリン受容体、ヒスタミン受容体、オピエート受容体などの他の受容体、特にドーパミンD<sub>2</sub>受容体に対するアフィニティが低いことから、他の相対的に選択性の低い5HT<sub>6</sub>リガンドより副作用が少ない驚くほど高選択性のドーパミン5HT<sub>6</sub>受容体リガンドである。一部の式Iの化合物は、5HT<sub>6</sub>受容体に対して、そして場合によりドーパミンD<sub>3</sub>受容体にも高いアフィニティを示す。D<sub>1</sub>受容体、D<sub>5</sub>受容体、D<sub>4</sub>受容体、1-アドレナリン受容体および/または2-アドレナリン受容体、ムスカリン受容体、ヒスタミン受容体、オピエート受容体などの他の受容体、特にドーパミンD<sub>2</sub>受容体に対するアフィニティが低いことから、それらは、D<sub>2</sub>受容体拮抗薬である従来の神経遮断薬などの他の選択性が相対的に低い化合物と比較して副作用が少ない。

10

## 【0178】

本発明の化合物は、部分作働薬活性を含むドーパミン5HT<sub>6</sub>受容体作働薬または逆作働薬活性を含むドーパミン5HT<sub>6</sub>受容体拮抗薬であることができる。

## 【0179】

本発明による化合物の5HT<sub>6</sub>受容体受容体に対する高アフィニティは、通常50nM(nmol/L)未満、好ましくは10nM未満、特に5nM未満の非常に低いイン・ビトロでの受容体結合定数(K<sub>i</sub>(5HT<sub>6</sub>)値)で反映されている。例えば、5-HT<sub>6</sub>受容体に対する結合アフィニティを求める受容体結合試験には、<sup>3</sup>H-LSDの置換を用いることができ、ドーパミンD<sub>3</sub>受容体に対するアフィニティを求めるには[<sup>125</sup>I]-ヨードスルプリドを用いる。

20

## 【0180】

ドーパミンD<sub>3</sub>受容体に対しても高アフィニティを有する本発明による化合物のD<sub>3</sub>/D<sub>2</sub>選択性、すなわち受容体結合定数の比K<sub>i</sub>(D<sub>2</sub>)/K<sub>i</sub>(D<sub>3</sub>)は、通常は少なくとも25、好ましくは少なくとも50、さらには少なくとも100である。例えばD<sub>1</sub>、D<sub>2</sub>およびD<sub>4</sub>受容体に関する受容体結合試験を行うには、[<sup>3</sup>H]SCH23390または[<sup>125</sup>I]スピペロンの置換を用いることができる。

30

## 【0181】

化合物は、その結合プロファイルのため、5HT<sub>6</sub>受容体リガンドおよび場合によりドーパミンD<sub>3</sub>リガンドに応答する(または5HT<sub>6</sub>受容体リガンドおよび場合によりドーパミンD<sub>3</sub>受容体リガンドでの治療に感受性である)疾患の治療において用いることができる。すなわちそれら化合物は、5HT<sub>6</sub>受容体に対する影響(調節)および場合によりドーパミンD<sub>3</sub>受容体に対する影響(調節)を行うことで、臨床像における改善または疾患の治癒を生じる医学的障害または疾患の治療において有効である。これらの疾患の例は、中枢神経系の障害または疾患である。

## 【0182】

中枢神経系の障害または疾患とは、脊髄および特に脳に影響を与える障害を意味するものと理解される。本発明による意味において「障害」という用語は、病的な状態または機能と通常見なされ、それ自体が特定の徴候、症状および/または機能不全の形で現れ得る障害および/または異常を指す。本発明による治療は、個々の障害、すなわち異常または病的状態に対するものであることができるが、それは本発明に従って治療が可能な、互いに原因的に関連していることでパターンにまとめられるいくつかの異常、すなわち症候群である可能性もある。

40

## 【0183】

本発明に従って治療可能な障害は、特に、5HT<sub>6</sub>受容体の調節に応答する障害である。それには、記憶、認識および学習における欠陥などの認知機能障害、特にアルツハイマー病、加齢性認識衰退および軽度認知障害に関連したもの、注意力欠如障害/多動性症候群、人格障害(統合失調症など)、特に統合失調症関連の認知障害、抑鬱、不安およ

50

び強迫性障害などの情動障害、パーキンソン病および癲癇などの動作または運動障害、片頭痛、睡眠障害（概日リズムの障害など）、食欲不振および過食症などの摂食障害、過敏性大腸症候群などのある種の消化管障害、卒中などの神経変性関連の疾患、脊髄または頭部の外傷および水頭症などの頭部損傷、薬物嗜癖および肥満などがある。

#### 【0184】

耽溺障害には、医薬または麻薬などの向精神剤の乱用によって生じる心理的障害および行動的障害、および強迫性賭博などの他の耽溺障害（他のものに分類されない衝動調節障害）などがある。常習性薬物の例には、オピオイド類（例：モルヒネ、ヘロイン、コデイン）；コカイン；ニコチン；アルコール；GABAクロライドチャンネル複合体と相互作用する物質、鎮静剤、睡眠薬または精神安定薬、例えばベンゾジアゼピン類；LSD；カンナビノイド類；3,4-メチレンジオキシ-N-メチルアンフェタミン（エクスタシー）などの精神運動興奮薬；メチルフェニデートおよびカフェインなどの他の刺激剤などのアンフェタミンおよびアンフェタミン様物質がある。特別の注意を必要とする常習性薬物は、オピオイド類、コカイン、アンフェタミンまたはアンフェタミン様物質、ニコチンおよびアルコールである。

10

#### 【0185】

耽溺障害の治療に関しては、特に好ましいものは、それ自体は向精神効果を持たない式Iの本発明による化合物である。それは、本発明に従って用いることができる化合物の投与後に、向精神剤、例えばコカインの自己投与を減らすラットを用いる試験で認めることもできる。

20

#### 【0186】

5HT<sub>6</sub>受容体ならびにドーパミンD<sub>3</sub>受容体に対して高いアフィニティを有する式Iの化合物は、ドーパミン作働性およびセロトニン作働性の両方の影響を有する障害、特にCNS障害の治療において有利に用いることができる。5HT<sub>6</sub>受容体の方が認識機能との関連が強いが、ドーパミンD<sub>3</sub>受容体は妄想、幻覚、支離滅裂な思考、支離滅裂な言動、支離滅裂的、激越性もしくは緊張病性行動などの陽性症状ならびに感情欠如、言語障害、意欲喪失、活力低下、注意欠陥および社会的引きこもりなどの陰性症状に関連している。そこで、5HT<sub>6</sub>受容体ならびにドーパミンD<sub>3</sub>受容体に対して高いアフィニティを有する式Iの化合物は、認知機能障害ならびに陽性および陰性症状を特徴とするアルツハイマー病、特に統合失調症などの障害を治療する上で有利に用いることができる。

30

#### 【0187】

本発明の別の態様によれば、本発明による化合物は、原因が少なくとも部分的に5HT<sub>6</sub>受容体の異常活性によるものである可能性がある障害の治療において好適である。

#### 【0188】

本発明の別の態様によれば、治療は特に、適切な医学的治療の意味で、好ましくは外因的に投与された5HT<sub>6</sub>受容体への結合相手（リガンド）の結合によって影響され得る障害に関するものである。

#### 【0189】

本発明による化合物によって治療可能な疾患は非常に多くの場合、漸進的進行を特徴とし、すなわち上記の状態が経時的に変化し、重度は通常は大きくなり、状態は交互に現れる可能性があるか、他の状態が以前からの既存の状態に加わるように思われる場合がある。

40

#### 【0190】

本発明による化合物は、中枢神経系の障害、特に上記の状態に関連する多くの徴候、症状および/または機能不全を治療するのに用いることができる。これらの徴候、症状および/または機能不全には例えば、現実に対する歪んだ関係、通常の世界規範および生活上の要求に従う洞察および能力の欠如、気質の変化、空腹、睡眠、口渇などの個人的衝動および気分における変化、観察および組み合わせを行う能力における障害、人格変化、特に情動不安定、幻覚、自我障害、滅裂、両価性、自閉症、離人症または幻覚、妄想観念、断続言語、連合運動の欠如、小股歩行、胴体および四肢の傾斜姿勢、振戦、顔面表現の

50

乏しさ、単調言語、抑鬱、感情鈍麻、自発性欠如および不決断、連合能力低下、不安、神経興奮、吃音、対人恐怖、パニック障害、依存性関連の禁断症状、誇大症候群、興奮状態および混乱状態、神経不安、運動障害症候群およびチック障害（例：ハンチントン舞踏病）、ジル-ド-ラ-ツレット症候群、眩暈症候群（例：末梢体位性、回転性および前庭性の眩暈）、うつ病、ヒステリー、心気症などがある。

【0191】

本発明による意味での治療には、急性もしくは慢性の徴候、症状および/または機能不全の治療だけでなく、予防的処置（予防）、特に再発もしくは相の予防としての処置も含まれる。治療は対症的であることができ、例えば症状の抑制に向けたものであることができる。それは短期で行うことができ、中期で行うことができ、または例えば維持療法の一環として長期治療であることもできる。

10

【0192】

本発明による化合物は、中枢神経系の疾患の治療に、より好ましくは認知機能障害の治療に、特に統合失調症またはアルツハイマー病に関連する認知機能障害の治療に特に好適である。

【0193】

治療の文脈の範囲内において、記載の化合物の本発明による使用には、方法が関与する。この方法では、概して医薬および動物薬の実務に従って製剤された有効量の1以上の化合物を治療対象の個体、好ましくは哺乳動物、特にヒト、繁殖動物または家畜に投与する。そのような治療が適応であるか否かおよびそれが取る形態は、個々の症例によって決まるものであり、存在する徴候、症状および/または機能不全、ある種の徴候、症状および/または機能不全発症のリスク、ならびに他の因子を考慮する医学的評価（診断）に従うものである。

20

【0194】

治療は通常、1日1回またはそれ以上、場合により他の活性化化合物もしくは活性化化合物含有薬と一緒にもしくは交互に投与することで行って、治療を受ける個体が、好ましくは経口投与の場合で約0.1 - 1000 mg/kgまたは非経口投与の場合で約0.1 - 100 mg/kgの1日用量の投与を受けるようにする。

【0195】

本発明はまた、個体、好ましくは哺乳動物、特にヒト、繁殖動物または家畜の治療用の医薬組成物の製造に関するものでもある。従って、前記リガンドは通常、少なくとも1種類の本発明による化合物と場合により他の活性化化合物とともに製薬上許容される賦形剤を含む医薬組成物の形態で投与される。それらの組成物は、例えば経口、直腸、経皮、皮下、静脈、筋肉または鼻腔内経路によって投与することができる。

30

【0196】

好適な医薬製剤の例には、粉剤、粒剤、錠剤、特にフィルムコート錠、ロゼンジ剤、小袋剤、カシェ剤、糖衣錠、硬ゼラチンカプセルおよび軟ゼラチンカプセルなどのカプセル、坐剤または腔製剤などの固体医薬製剤；軟膏、クリーム、ヒドロゲル、ペーストまたは貼付剤などの半固体医薬製剤；および液剤、乳濁液、特に水中油型乳濁液、懸濁液、例えばローション、注射製剤および注入用製剤ならびに点眼剤および点耳剤などの液体医薬製剤がある。埋め込み投与機器を用いて、本発明による阻害薬を投与することもできる。さらに、リポソームやマイクロスフェアの使用も可能である。

40

【0197】

組成物を製造する場合、本発明による化合物を場合により1以上の賦形剤と混合またはそれで希釈する。賦形剤は、活性化化合物用の媒体、担体または媒質として働く固体、半固体または液体材料であることができる。

【0198】

好適な賦形剤は、専門の医薬研究書に列記されている。前記製剤はさらに、製薬上許容される担体または潤滑剤；湿展剤；乳化剤および懸濁剤；保存剤；酸化防止剤；抗刺激剤；キレート剤；コート助剤；乳濁液安定剤；フィルム形成剤；ゲル形成剤；臭気マスク剤

50

；矯味薬；樹脂；親水コロイド；溶媒；溶解剤；中和剤；拡散促進剤；顔料；4級アンモニウム化合物；再脂肪剤および過脂肪剤；軟膏、クリームもしくはオイル基剤；シリコン誘導体；展着助剤；安定剤；滅菌剤；坐剤基剤；結合剤、充填剤、潤滑剤、崩壊剤もしくはコーティング剤などの錠剤賦形剤；推進剤；乾燥剤；乳白剤；増粘剤；ロウ類；可塑剤；白油などの従来補助物質を含むことができる。これに関する製剤は、文献（例えば、Fiedler, H.P., Lexikon der Hilfsstoffe für Pharmazie, Kosmetik and angrenzende Gebiete [Encyclopedia of auxiliary substances for pharmacy, cosmetics and related fields], 4<sup>th</sup> edition, Aulendorf: ECV-Editio-Kantor-Verlag, 1996）に記載の専門知識に基づいたものである。

【0199】

10

さらに、ドーパミン作動性およびセロトニン作動性の両方の影響を有する障害は、ドーパミンD<sub>3</sub>受容体リガンドおよび5HT<sub>6</sub>受容体リガンドの併用によっても治療可能であることが認められている。この併用は驚くべきことに、有害効果を全く示さない。

【0200】

従って、本発明のさらに別の態様は、ドーパミンD<sub>3</sub>受容体に対してアフィニティを有する少なくとも一つの化合物および5HT<sub>6</sub>受容体に対してアフィニティを有する少なくとも一つの化合物および場合により少なくとも一つの生理的に許容される担体および/または補助物質を含む医薬組成物に関するものである。

【0201】

本発明はさらに、中枢神経系の疾患の治療のための医薬品を製造する上での5HT<sub>6</sub>受容体に対してアフィニティを有する少なくとも一つの化合物と組み合わせたドーパミンD<sub>3</sub>受容体に対してアフィニティを有する少なくとも一つの化合物または上記で定義の医薬組成物の使用に関するものである。

20

【0202】

本発明に従って使用される化合物またはドーパミンD<sub>3</sub>受容体に対してアフィニティを有する上記医薬組成物中の化合物は、好ましくは5HT<sub>6</sub>受容体に対して全く活性を持たないかほとんど活性を持たないものであり、その逆も言える。好ましくは、ドーパミンD<sub>3</sub>受容体に対してアフィニティを有する化合物は、多くとも150nMのドーパミンD<sub>3</sub>受容体に対する結合定数K<sub>i</sub>を有し、5HT<sub>6</sub>受容体に対してアフィニティを有する化合物は、多くとも150nMの5HT<sub>6</sub>受容体に対する結合定数K<sub>i</sub>を有する。より好ましくは、ドーパミンD<sub>3</sub>受容体に対してアフィニティを有する化合物は、少なくとも10、より好ましくは少なくとも25、特に少なくとも50のD<sub>3</sub>ドーパミン受容体対5HT<sub>6</sub>受容体の選択性、すなわちK<sub>i</sub>(5HT<sub>6</sub>)/K<sub>i</sub>(D<sub>3</sub>)を有し、5HT<sub>6</sub>ドーパミン受容体に対してアフィニティを有する化合物は、少なくとも10、より好ましくは少なくとも25、特に少なくとも50の5HT<sub>6</sub>受容体対D<sub>3</sub>ドーパミン受容体の選択性、すなわちK<sub>i</sub>(D<sub>3</sub>)/K<sub>i</sub>(5HT<sub>6</sub>)を有する。

30

【0203】

ドーパミンD<sub>3</sub>受容体に対してアフィニティを有する化合物は広く知られており、例えば、下記の刊行物：WO2006/058753、WO2006/040176、WO2006/040177、WO2006/040178、WO2006/040179、WO2006/0040180、WO2006/008592、WO2006/015842、WO2005/058328、WO2004/89905、WO2004/108706、WO2004/080981、WO2004/069830、WO01/72306、WO00/67847、WO00/42038、WO99/09015、WO99/02503、WO97/25324、WO96/002519（これらの内容は、参照によって全体が本明細書に組み込まれる。）に記載されている。

40

【0204】

好ましいドーパミンD<sub>3</sub>受容体に対してアフィニティを有する化合物は、ドーパミンD<sub>3</sub>受容体拮抗薬である。

【0205】

50

ドーパミン 5HT<sub>6</sub> 受容体に対してアフィニティを有する化合物は広く知られており、例えば、下記の刊行物：WO 2006/081322、WO 2005/040124、WO 2003/080580、WO 2002/032863、WO 00/05225、WO 98/27081 およびツアオらの報告 (S. -H. Zhao et al., Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2007) (これらの内容は、参照によって全体が本明細書に組み込まれる。) に記載されている。

【0206】

好ましいドーパミン 5HT<sub>6</sub> 受容体に対してアフィニティを有する化合物は、ドーパミン 5HT<sub>6</sub> 受容体拮抗薬である。

【0207】

本発明の好ましい実施形態では、ドーパミン 5HT<sub>6</sub> 受容体に対してアフィニティを有する化合物は本発明の式 I の化合物である。より好ましい化合物は、好ましいものとして上記で言及した化合物 I である。

【0208】

驚くべきことに、ドーパミン D<sub>3</sub> 受容体に対してアフィニティを有する化合物および少なくとも一つの 5HT<sub>6</sub> 受容体に対してアフィニティを有する化合物の組み合わせは、有害効果を全く持たない。これは、実施例に記載のアッセイ (微小透析試験) によって証明することができる。特に、一方または他方の受容体に対する結合アフィニティは低下しない。

【0209】

下記の実施例は、本発明を説明するためのものであり、本発明を限定するものではない。

【0210】

化合物は、別段の断りがない限り 400 MHz または 500 MHz NMR 装置 (Bruker AVANCE) での d<sub>6</sub>-ジメチルスルホキシドまたは d-クロロホルム中にてのプロトン-NMR によって、または C18 材料での急勾配での HPLC-MS によって記録される質量分析 (エレクトロスプレーイオン化 (ESI) モード) または融点によって特性決定した。

【0211】

核磁気共鳴スペクトル特性 (NMR) は、百万分の部数単位 (ppm) で表現される化学シフト ( ) に関するものである。<sup>1</sup>H NMR スペクトラムにおけるシフトの相対面積は、分子中の特定の機能型における水素原子の数に相当する。多重性に関するシフトの性質は、一重線 (s)、広い一重線 (s. br.)、二重線 (d)、広い二重線 (d br.)、三重線 (t)、広い三重線 (t br.)、四重線 (q)、五重線 (quint.) および多重線 (m) として示される。

【0212】

製造実施例

I. 化合物 I の製造

【実施例 1】

【0213】

3-ジフルオロメトキシ-N-[2-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-ピリジン-4-イル]-ベンゼンスルホンアミド

To 2-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-4-アミノ-ピリジン 200 mg (1.04 mmol) のピリジン (5 mL) 溶液に、3-ジフルオロメトキシベンゼンスルホニルクロライド (1.66 mmol) の 272 mg (1.12 mmol) を加え、反応混合物を室温で 15 時間攪拌した。溶媒を減圧下に留去し、残留物をジクロロメタンに溶かした。この混合物を NaHCO<sub>3</sub> 水溶液で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下に留去した。粗生成物を、溶離液としてエチルジクロロメタン/メタノール (0-15%) を用いるシリカゲルクロマトグラフィーによって精製して、精製生成物 231 mg を得た。

10

20

30

40

50

## 【0214】

E S I - M S : 399.1 [ M + H ] <sup>+</sup> .

## 【0215】

<sup>1</sup> H - N M R ( D M S O ) : [ p p m ] 7.8 ( d , 1 H ) , 7.7 ( d , 1 H ) , 7.65 ( t , 1 H ) , 7.6 ( s , 1 H ) , 7.45 ( d , 1 H ) , 7.3 ( t , 1 H ) , O C H F <sub>2</sub> ) , 6.4 ( d , 1 H ) , 6.35 ( s , 1 H ) , 3.35 ( 広い , 4 H ) , 2.4 ( 広い , 4 H ) , 2.2 ( s , 3 H ) .

## 【実施例2】

## 【0216】

4 - イソプロピル - N - [ 5 - ピペラジン - 1 - イル - ピリジン - 3 - イル ] - ベンゼン  
スルホンアミド・H C l

2.1 : 1 - ベンジル - 4 - ( 5 - プロモ - ピリジン - 3 - イル ) - ピペラジン

1 - ベンジル - ピペラジン ( 1.49 g , 8.44 m m o l ) , 3 , 5 - ジプロモ - ピリジン ( 2.00 g , 8.44 m m o l ) および炭酸カリウム ( 1.17 g , 8.44 m m o l ) の D M F ( 15 m L ) 中混合物を、窒素雰囲気下に 200 で 1 時間加熱した。次に、混合物を水 100 m L で希釈し、酢酸エチルで 2 回抽出した。合わせた有機層を H C l 水溶液で抽出した。その水溶液の p H を、N a O H 水溶液で p H 10 に調節した。ジエチルエーテルで抽出後、合わせた有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下に留去した。そうして得られた油状物を、溶離液としてシクロヘキサン / 酢酸エチル ( 2 : 1 ) を用いるシリカゲルクロマトグラフィーによって精製して、生成物 0.32 g を得た。

## 【0217】

E S I - M S : 333.1 [ M + H ] <sup>+</sup> .

## 【0218】

2.2 : N - [ 5 - ( 4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル ) - ピリジン - 3 - イル ] - 4 - イソプロピル - ベンゼン  
スルホンアミド

1 - ベンジル - 4 - ( 5 - プロモ - ピリジン - 3 - イル ) - ピペラジン ( 320 m g , 0.88 m m o l ) のトリフルオロメチルベンゼン ( 5 m L ) 溶液にアルゴン雰囲気下で、P d <sub>2</sub> ( d b a ) <sub>3</sub> ( 40 m g , 0.04 m m o l ) およびトリ - t e r t - ブチル - ホスファン ( 27 m g , 0.13 m m o l ) を加えた。別のフラスコに入った 4 - イソプロピルベンゼンスルホンアミド ( 175 m g , 0.88 m o l ) のトリフルオロメチルベンゼン ( 10 m L ) 溶液に、50 で水素化ナトリウム ( 50 % , 42 m g , 0.88 m m o l ) を加えた。この第 2 の溶液を、室温まで冷却した後に、第 1 の溶液に加えた。混合物をマイクロ波装置 ( C E M ) 中にて 150 で 1 時間加熱した。減圧下での溶媒留去後、混合物を水 50 m L で希釈し、酢酸エチル 25 m L で抽出した。合わせた有機層を H C l 水溶液で抽出した。水溶液の p H を、N a O H 水溶液で p H 9 に調節した。酢酸エチルで抽出後、合わせた有機相を硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、溶媒を減圧下に留去した。そうして得られた油状物を、溶離液としてシクロヘキサン / 酢酸エチル ( 3 : 7 ) を用いるシリカゲルクロマトグラフィーによって精製して、生成物 100 m g を得た。

## 【0219】

E S I - M S : 451.1 [ M + H ] <sup>+</sup> .

## 【0220】

2.3 : 4 - イソプロピル - N - [ 5 - ピペラジン - 1 - イル - ピリジン - 3 - イル ] - ベンゼン  
スルホンアミド・H C l

N - [ 5 - ( 4 - ベンジルピペラジン - 1 - イル ) - ピリジン - 3 - イル ] - 4 - イソプロピルベンゼンスルホンアミド ( 100 m g , 0.22 m m o l ) および 10 % パラジウム / 活性炭 ( 10 m g ) のメタノール ( 20 m L ) 中混合物を、水素が完全に消費されるまで大気圧下に水素化した。濾過および減圧下での溶媒留去後、残留物を水および 1 N H C l 0.5 m L に溶かし、凍結乾燥させて、標題化合物 78 m g を得た。

## 【0221】

10

20

30

40

50

E S I - M S : 3 6 2 . 1 [ M + H ] <sup>+</sup> .

【実施例 3】

【0222】

4 - イソプロピル - N - [ 5 - ( 4 - プロピル - ピペラジン - 1 - イル ) - ピリジン - 3 - イル ] - ベンゼンスルホンアミド

4 - イソプロピル - N - [ 5 - ピペラジン - 1 - イル - ピリジン - 3 - イル ] - ベンゼンスルホンアミド 30 mg ( 0 . 0 8 mmol ) をテトラヒドロフラン 5 mL に溶かし、酢酸 6 . 9 mg、プロピオンアルデヒド 4 . 4 mg ( 0 . 0 8 mmol ) および水素化ホウ素トリアセトキシナトリウム 32 mg ( 0 . 1 5 mmol ) を少量ずつゆっくり加えた。室温で 120 分間攪拌後、溶媒を留去し、水を加え、pH を pH 8 に調節した。水相をジエチルエーテルで 3 回抽出し、有機相を合わせ、硫酸マグネシウムで脱水し、濾過し、減圧下に溶媒留去して乾固させた。残留物を水 25 mL および 1 N H C l 0 . 5 mL に溶かし、混合物を凍結乾燥して生成物 25 mg を得た。

10

【0223】

E S I - M S : 4 0 4 . 1 [ M + H ] <sup>+</sup> .

【0224】

II . 医薬投与製剤例

A ) 錠剤

下記組成の錠剤を、従来の方法で打錠機で圧縮する。

【0225】

20

実施例 8 の物質 40 mg

コーンスターチ 120 mg

ゼラチン 13 . 5 mg

乳糖 45 mg

エアロジル (Aerosil ; 登録商標) ( 超顕微鏡的に微細な分布での化学的に純粋なケイ酸 ) 2 . 25 mg

ジャガイモデンプン ( 6 % ペーストとして ) 6 . 75 mg 。

【0226】

B ) 糖衣錠

実施例 8 の物質 20 mg

コア組成物 60 mg

糖化組成物 70 mg 。

30

【0227】

コア組成物は、コーンスターチ 9 部、乳糖 3 部、ビニルピロリドン / 酢酸ビニル 60 : 40 コポリマー 1 部からなる。糖化組成物は、ショ糖 5 部、コーンスターチ 2 部、炭酸カルシウム 2 部およびタルク 1 部からなる。このようにして製造された糖衣錠には次に、胃液耐性コーティングを施す。

【0228】

III . 生物学的検討

受容体結合試験

40

被験物質を、メタノール / クレモホル ( 登録商標 ) ( B A S F - A G ) またはジメチルスルホキシドに溶かし、水で希釈して所望濃度とした。

【0229】

ヒト 5 H T <sub>6</sub> 受容体 :

結合アッセイおよび機能性アデニルシクラーゼアッセイでのヒト 5 - H T <sub>6</sub> 受容体に対する本発明の化合物の特性決定

化合物を、 $10^{-2}$  M または  $10^{-3}$  M の濃度で D M S O に溶かした。インキュベーション緩衝液でさらに希釈を行った。

【0230】

結合アッセイ

50

結合アッセイの手順は、モンスマらの方法 (Monsma et al. (1993) Mol Pharmacol 43: 320-327) に基づいたものであった。結合反応は、37 で60分間にわたり、総容量0.250 mLで行った。ヒト5-HT<sub>6</sub>受容体を安定に発現するHEK-293細胞からの膜を、37 で60分間にわたり、各種濃度の被験化合物の存在下または非存在下に2 nMの<sup>3</sup>H-LSDとともにインキュベートした。非特異的結合は、100 μMセロトニン(5-HT)を用いて定義した。アッセイは二連で行った。結合および遊離放射性リガンドを濾過によって分離し、結合放射能を液体シンチレーションカウンティングによって測定した。

【0231】

評価:

受容体に対する特異的リガンド結合は、総結合と過剰の未標識5-HTの存在下に測定した非特異的結合との間の差と定義した。結果は、化合物存在下に得られた対照特異的結合のパーセントとして表している。IC<sub>50</sub>値(対照特異的結合の最大障害の1/2を生じる濃度)およびヒル係数(nH)を、ヒル式曲線適合を用いる競合曲線の非線形回帰分析によって求めた。

【0232】

阻害定数(K<sub>i</sub>)を、チェン-ブルソフ(Cheng Prusoff)式( $K_i = IC_{50} / (1 + (L / KD))$ ) (式中、L = アッセイ中の放射性リガンドの濃度、およびKD = 受容体に対する放射性リガンドのアフィニティ)から計算した。

【0233】

機能性アデニルシクラーゼアッセイ

ヒト5-HT<sub>6</sub>受容体を安定に発現するヒトHeLa細胞の膜を、被験化合物の存在下および非存在下にてHBSS、1 mM MgCl<sub>2</sub>、1 mM CaCl<sub>2</sub>、100 mM IBMX、pH 7.4中にて37 で20分間インキュベートした。作働薬効果に関しては、化合物を単独でインキュベートした。拮抗薬効果に関しては、0.3 μMセロトニン(5-HT)誘発cAMP増加の障害を求めた。

【0234】

評価: cAMP蓄積を、EIA定量によって測定した。

【0235】

ドーパミンD<sub>3</sub>受容体:

アッセイ混合物(0.250 mL)は、安定に発現されたヒトドーパミンD<sub>3</sub>受容体、0.1 nM [<sup>125</sup>I]-ヨードスルプリドおよびインキュベーション緩衝液を加えた(全結合)、または別の試験物質(阻害プロット)もしくは1 μMスピペロン(非特異的結合)を加えたHEK-293細胞約10<sup>6</sup>個由来の膜からなるものとした。各アッセイ混合物を、3連で調べた。

【0236】

インキュベーション緩衝液は、50 mM Tris、120 mM NaCl、5 mM KCl、2 mM CaCl<sub>2</sub>、2 mM MgCl<sub>2</sub>および0.1%ウシ血清アルブミン、10 μMキノロン、0.1%アスコルビン酸(毎日新鮮なものを調製)を含むものとした。緩衝液は、HClによってpH 7.4に調節した。

【0237】

ドーパミンD<sub>2L</sub>受容体:

アッセイ混合物(1 mL)は、安定に発現されたヒトドーパミンD<sub>2L</sub>受容体(長いイソ型)および0.01 nM [<sup>125</sup>I]-ヨードスピペロンおよびインキュベーション緩衝液を加えた(全結合)、またはさらに試験物質(阻害曲線)もしくは1 μMハロペリドール(非特異的結合)を加えたHEK-293細胞約10<sup>6</sup>個からの膜からなるものであった。各アッセイ混合物を3連で調べた。

【0238】

インキュベーション緩衝液は、50 mM Tris、120 mM NaCl、5 mM KCl、2 mM CaCl<sub>2</sub>、2 mM MgCl<sub>2</sub>および0.1%ウシ血清アルブミンを

10

20

30

40

50

含むものとした。緩衝液は、HClによってpH7.4に調節した。

【0239】

測定および解析：

25で60分間インキュベーション後、アッセイ混合物を減圧下に、細胞回収装置を用いてワットマン(Whatman)GF/Bガラスファイバーフィルターで濾過した。フィルターを、フィルター移動システムによってシンチレーションバイアル中に移動させた。ウルティマ・ゴールド(Ultima Gold;登録商標)(パッカード(Packard))4mLを加えた後、サンプルを1時間振盪し、放射能を - カウンタでカウントした(パッカード、トリカーブ(Tricarb)2000または2200CA)。標準クエンチシリーズおよび装置に搭載のプログラムを用いて、cpm値をdpmに変換した。

10

【0240】

阻害曲線の解析を、ムンソンらの報告(Munson and Rodbard)に記載の「LIGAND」プログラムと同様の統計解析システム(SAS)を用いる反復非線形回帰分析によって行った。

【0241】

受容体結合試験の結果は、本明細書で前述し、表6に示したように、それぞれ受容体結合定数 $K_i$ (5HT<sub>6</sub>)、 $K_i$ (D<sub>3</sub>)および $K_i$ (D<sub>2</sub>)として表してある。

【0242】

これらの試験において、本発明による化合物は、5HT<sub>6</sub>受容体に対して非常に良好なアフィニティを示した(<50nMまたは<10nM、非常に多くの場合<5nM)。それら化合物のうちの一部は、D<sub>3</sub>受容体に対しても非常に良好なアフィニティを示し(<50nMまたは<10nM、非常に多くの場合<5nM)、D<sub>2</sub>受容体に対するアフィニティと比較してD<sub>3</sub>受容体に選択的に結合する。

20

【0243】

IV.ドーパミンD<sub>3</sub>および5HT<sub>6</sub>受容体リガンドの適合性を調べるためのアッセイ  
微小透析試験

コリン作働性機能の亢進が、認識能力を向上させると広く考えられており、皮質細胞外アセチルコリン(ACh)の増加を、可能な認識促進(procognitive)効果についての生化学的マーカーと見なすことができる。

【0244】

従って、自由に運動するラットでの微小透析試験を行った。5-HT<sub>6</sub>受容体リガンド、選択的D<sub>3</sub>リガンドまたは両方の要素の組み合わせが内側前頭前野および海馬でのアセチルコリン放出に対する効果に関して調べた。1本のガイドカニューレを内側前頭前野に埋め込み(AP=2.5;ML=0.6;DV=-0.2)、第2のものを海馬に埋め込んだ(AP=-5.5;ML=4.5;DV=-4.5)。手術から5から7日後に、2個の微小透析プローブ(CMA/12、3mm膜長さ)をゆっくり下げて最終位置とした。実験当日、試験化合物またはその媒体(2mL/kg)を腹腔内投与した。微小透析液画分(化合物投与前で6個の20分画分および化合物投与後の6個の画分)を、化学的検出と組み合わせた高速液体クロマトグラフィーにより、アセチルコリンについて分析した(方法については、Fox et al., J. Pharmacol. Exp. Ther. 2005, 313, 176 to 190および下記の詳細な説明を参照。 )。

30

40

【0245】

5-HT<sub>6</sub>受容体リガンドおよび選択的D<sub>3</sub>受容体リガンドは、内側前頭前野および海馬において細胞外AChレベルを用量依存的に上昇させた。5-HT<sub>6</sub>受容体リガンドとD<sub>3</sub>受容体リガンドの両方の組み合わせにより、内側前頭前野および海馬において両方の要素の少なくとも相加的効果が得られ、従って、両方の要素の組み合わせが、認知症および統合失調症などの認知機能障害を特徴とするCNS障害において治療効果をもたらすことが示唆される。

【0246】

さらに、混合D<sub>3</sub>/5-HT<sub>6</sub>受容体リガンドは、内側前頭前野および海馬での微小透

50

析液 A C h レベルも高めた。用量比較に基づくと、分子内で D<sub>3</sub> / 5 - H T<sub>6</sub> を組み合わせた化合物は、「純粋な」D<sub>3</sub> 受容体拮抗薬より、皮質コリン作働性機能の亢進においてより強力である。

#### 【0247】

##### 微小透析実験

##### 手術

疼痛を予防するため、リマジル (Rimadyl ; 登録商標) ( 3 m g / k g 、腹腔内投与) を、手術前に投与した。ペントバルビタール ( 6 0 m g / k g 、腹腔内投与、ナルコレン (Narcoren ; 登録商標)、ローヌ・メリュール (Rhone-Merieux) G m b H、フランス) で麻酔を施した個々の雄スプレーグドーリーラット ( 体重 2 9 0 - 3 2 0 g ) を、K O P F 定位固定フレームに乗せ、2 本の微小透析ガイドカニューレ ( C M A / 1 2、アクセル・セムロー (Axel Semrau) G m b H、ドイツ) を、同動物の選択された脳領域に埋め込んだ。1 本のガイドカニューレは内側前頭前野中に埋め込み ( A P = 2 . 5 ; M L = 0 . 6 ; D V = - 0 . 2 )、第 2 のものは海馬に埋め込んだ ( A P = - 5 . 5 ; M L = 4 . 5 ; D V = - 4 . 5 )。ガイドカニューレを歯科用セメント ( テクノビット (Technovit) 粉末、製品番号 5 0 7 1、テクノビット重合開始剤液、製品番号 2 0 6 0、クルザー (Kulzer) G m b H、ドイツ) で固定し、4 個のアンカーを頭蓋骨にねじ込んだ。ラットを 5 - 7 日間にわたり手術から回復させた。実験前日、各動物を、自由な運動が可能なシステム ( C M A / 1 2 0 アクセル・セムロー G m b H、ドイツ ; プラスチック製ボウル、針金製取り付け具、釣り合いアーム、灌流ポンプとプローブの入口 / 出口をつなぐ旋回型組立部品から構成) に移し入れた。次に、C M A / 1 2 微小透析プローブ ( 3 m m 膜長さ) を、ゆっくり下げて最終位置に入れた。プローブをリンゲル液 ( 1 4 7 m M NaCl、4 . 0 m M KCl および 2 . 4 m M CaCl<sub>2</sub>、1 μ M のネオスチグミンを含有) で、約 1 時間灌流させた ( C M A / 1 0 2 微小透析ポンプ、アクセル・セムロー G m b H、ドイツ ; 1 . 5 μ L / 分)。2 4 時間後に、プローブを再度 1 時間にわたって灌流させてから、微小透析液画分を 2 0 分ごとに採取した。試験化合物または媒体の腹腔内投与前の画分 6 個と投与後の画分 6 個について、電気化学的検出を用いる H P L C によってアセチルコリンの微小透析液レベルを分析した。

10

20

#### 【0248】

##### 微小透析液アセチルコリンレベルのアッセイ

各微小透析液画分 1 0 μ L を、冷蔵自動サンプリング装置 ( H T C P A L ツインインジェクター自動サンプル装置システム、アクセル・セムロー、ドイツ) を用いて、逆相カラム ( M F - 8 9 0 8 アセチルコリン・セプスティック・キット (MF-8908 Acetylcholine SepStik Kit) ; マイクロボアカラム、粒径 1 0 μ m、固定化酵素リアクター ( 5 0 × 1 . 0 m m、粒径 1 0 μ m、アセチコリンエステラーゼおよびコリンオキシダーゼ含有 ; B A S、米国) に 5 3 0 × 1 . 0 m m 連結) に注入した。移動相は、5 0 m m o l / L の N a<sub>2</sub> H P O<sub>4</sub> ( p H 8 . 5 ) および 5 m L / L の ケーソン (Kathon) からなるものであった。流量は 0 . 1 4 m L / 分 ( レオス・フラックス・ポンプ (Rheos Flux pump)、アクセル・セムロー G m b H、ドイツ) であり、サンプル走査時間は 1 5 分間未満とした。アセチルコリンおよびコリンを、A g / A g C l 参照電極に対して + 5 0 0 m V に設定された白金作業電極を用いる電気化学検出器 ( L C - 4 C、B A S、米国) によって測定した。そのシステムは、1 p m o l / 1 0 μ L 注入を含む標準溶液 ( アセチルコリン、コリン) によって校正した。アセチルコリンは、その保持時間およびクロマトグラフィーソフトウェア ( クロム・パーフェクト (Chrom Perfect ( 登録商標)、バージョン 4 . 4 . 2 2、ジャスティス・ラボラトリー・ソフトウェア (Justice Laboratory Software)、米国) を用いる外部標準法でのピーク高さによって確認した。

30

40

#### 【0249】

微小透析 ( 曲線下面積 0 - 1 2 0 分) データについて、一元配置分散分析 ( A N O V A ) と、次にグラフパッド・プリズム ( GraphPad Prism) バージョン 4 . 0 ソフトウェアを用いるダネットの対比較事後検定を用いて、有意差の評価を行った。

50

## 【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International application No PCT/EP2007/053808
<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b>		
INV. C07D401/04 C07D401/14 C07D413/14 C07D417/14 A61K31/4545 A61P25/00		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b>		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A61K A61P		
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, WPI Data, CHEM ABS Data		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2005/113539 A (GLAXO GROUP LTD [GB]; JOHNSON CHRISTOPHER NORBERT [GB]; STEMP GEOFFREY) 1 December 2005 (2005-12-01) the whole document	1,25,26, 30,34
P,X	WO 2006/063718 A (HOFFMANN LA ROCHE [CH]; NETTEKOVEN MATTHIAS HEINRICH [DE]; ROCHE OLIVI) 22 June 2006 (2006-06-22) page 13, lines 2,3	1,2,4,6, 7,9-12, 19,20,25
<input 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  20 July 2007		Date of mailing of the international search report  30/07/2007
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  Diederien, Jeroen

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.  
PCT/EP2007/053808

**Box II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)**

This International Search Report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1.  Claims Nos.:  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:  
  
Although claims 26-29 are directed to a method of treatment of the human/animal body, the search has been carried out and based on the alleged effects of the compound/composition.
2.  Claims Nos.:  
because they relate to parts of the International Application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful International Search can be carried out, specifically:
3.  Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this International application, as follows:

1.  As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers all searchable claims.
2.  As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3.  As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4.  No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this International Search Report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
- No protest accompanied the payment of additional search fees.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2007/053808

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2005113539 A	01-12-2005	EP 1756083 A1	28-02-2007
WO 2006063718 A	22-06-2006	US 2006135528 A1	22-06-2006

## フロントページの続き

(51) Int.Cl.		F I	テーマコード (参考)
<b>A 6 1 K 45/00 (2006.01)</b>		A 6 1 K 45/00	
<b>A 6 1 K 31/496 (2006.01)</b>		A 6 1 K 31/496	

(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, 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, 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 100103920

弁理士 大崎 勝真

(74) 代理人 100124855

弁理士 坪倉 道明

(72) 発明者 グランデル, ローラント

ドイツ国、6 9 2 2 1・ドツセンハイム、ビルケンベーク・4 9

(72) 発明者 ブラーイエ, ビルフリート・マルティン

ドイツ国、3 1 7 3 7・リンテルン、ウンター・デム・ホプフェンベルゲ・1 5

(72) 発明者 ハウプト, アンドレーアス

ドイツ国、6 8 7 2 3・シユベエツツインゲン、シヤエルツイヒベーク・5 2

(72) 発明者 ターナー, シーン・コルム

ドイツ国、6 8 1 6 5・マンハイム、ラメイシユトラーセ・2 1

(72) 発明者 ランゲ, ウド

ドイツ国、1 3 5 9 3・ベルリン、フオルクンガーシユトラーセ・1 9

(72) 発明者 ドレシヤー, カルラ

ドイツ国、6 9 2 2 1・ドツセンハイム、ウンターレス・ピース・1 0

(72) 発明者 ウンガー, リリアーヌ

ドイツ国、6 7 0 6 5・ルートビヒスハーフェン、ブオルシユトラーセ・1 2 9

F ターム (参考) 4C055 AA01 BA01 BA02 BA52 BB10 CA01 CA03 CA52 CB16 DA52

DB16 FA01

4C084 AA19 MA02 NA05 ZA021 ZA151 ZA161 ZA181 ZC411 ZC751

4C086 AA01 AA02 AA03 BC50 GA07 GA08 GA12 MA01 MA02 MA04

NA14 ZA02 ZA15 ZA16 ZA18 ZC41