

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2012-6976

(P2012-6976A)

(43) 公開日 平成24年1月12日(2012.1.12)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
<b>C07D 471/04 (2006.01)</b>	C07D 471/04 105C	4C065
<b>A61K 31/4745 (2006.01)</b>	C07D 471/04 CSP	4C085
<b>A61K 31/437 (2006.01)</b>	A61K 31/4745	4C086
<b>A61P 35/00 (2006.01)</b>	C07D 471/04 107E	
<b>A61P 33/06 (2006.01)</b>	A61K 31/437	

審査請求 有 請求項の数 1 O L (全 162 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2011-208755 (P2011-208755)	(71) 出願人	505005049
(22) 出願日	平成23年9月26日 (2011. 9. 26)		スリーエム イノベイティブ プロパティ
(62) 分割の表示	特願2006-541697 (P2006-541697)		ズ カンパニー
	の分割		アメリカ合衆国, ミネソタ州 55133
原出願日	平成16年11月24日 (2004. 11. 24)		-3427, セント ポール, ポスト オ
(31) 優先権主張番号	60/524, 961		フィス ボックス 33427, スリーエ
(32) 優先日	平成15年11月25日 (2003. 11. 25)		ム センター
(33) 優先権主張国	米国 (US)	(74) 代理人	100099759
(31) 優先権主張番号	60/580, 139		弁理士 青木 篤
(32) 優先日	平成16年6月16日 (2004. 6. 16)	(74) 代理人	100077517
(33) 優先権主張国	米国 (US)		弁理士 石田 敬
		(74) 代理人	100087871
			弁理士 福本 積
		(74) 代理人	100087413
			弁理士 古賀 哲次

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 置換されたイミダゾ環系および方法

(57) 【要約】

【課題】 サイトカイン生合成またはその他の機序の誘導によって免疫応答を変調する能力を有する化合物を提供する。

【解決手段】 1位において置換されたイミダゾ環系、同化合物を含有する医薬組成物、中間体、同化合物を製造する方法、および動物においてサイトカイン生合成を誘導するための、そして、ウイルス性及び新生物疾患をはじめとする疾患の処置におけるこれらの化合物の免疫調節物質としての使用。

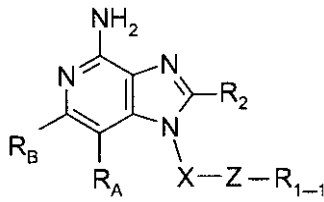
【選択図】 なし

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

以下の式 ( I - 1 ) :

## 【化 1】



I - 1

10

{ 式中、

X は任意に 1 つ以上の - O - 基によって中断されるアルキレンであり、

Z は - C ( O ) - 、 - C ( O ) O - 、または - C ( - Q - R<sub>1-3</sub> )<sub>2</sub> - であり、

R<sub>1-1</sub> は、

水素、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C ( O ) - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C ( O ) - NH<sub>2</sub>、

- NH - C ( O ) - NH - R<sub>1-4</sub>、および

- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、

アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリール

からなる群から選択されるが、

ただし Z が - C ( O ) - であれば R<sub>1-1</sub> は - N ( CH<sub>3</sub> ) ( OCH<sub>3</sub> ) であってもよく、

さらにただし Z が - C ( O ) O - であれば R<sub>1-1</sub> は水素でなく、

さらにただし Z が - C ( O ) O - であれば X は - O - 基を含まず、

Q は O または S であり、

R<sub>1-3</sub> は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

20

30

40

50

アルキレン - ヘテロアリアル、並びに

ハロゲン、  
シアノ、  
ニトロ、  
アルコキシ、  
ジアルキルアミノ、  
アルキルチオ、  
ハロアルキル、  
ハロアルコキシ、  
アルキル、

10

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、  
- NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、  
- NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、  
- NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および  
- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリアル、アルキレン - アリアル、ヘテロアリアル、またはアルキレン - ヘテロアリアル

からなる群から選択され、

または R<sub>1-3</sub>基は一緒になって飽和または不飽和5 -、6 -、または7 - 員環を含んでなる環系を形成でき、

20

R<sub>1-4</sub>は、  
アルキル、  
アリアル、  
アルキレン - アリアル、  
ヘテロアリアル、  
アルキレン - ヘテロアリアル、並びに

ハロゲン、  
シアノ、  
ニトロ、  
アルコキシ、  
ジアルキルアミノ、  
アルキルチオ、  
ハロアルキル、  
ハロアルコキシ、  
アルキル、および  
- N<sub>3</sub>

30

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリアル、アルキレン - アリアル、ヘテロアリアル、またはアルキレン - ヘテロアリアル

からなる群から選択され、そして

R<sub>2</sub>は、  
- R<sub>4</sub>、  
- X' - R<sub>4</sub>、  
- X' - Y' - R<sub>4</sub>、および  
- X' - R<sub>5</sub>

40

からなる群から選択され、

X'はアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アリーレン、およびヘテロアリーレンからなる群から選択され、ここで前記アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレン基は、アリーレンまたはヘテロアリーレンで任意に中断または終端されることができ、任意に1つ以上の - O - 基によって中断され、

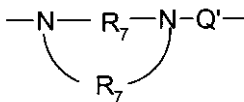
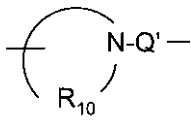
Y'は、

50

- S ( O )<sub>0-2</sub> - 、
- S ( O )<sub>2</sub> - N ( R<sub>8</sub> ) - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - O - 、
- O - C ( R<sub>6</sub> ) - 、
- O - C ( O ) - O - 、
- N ( R<sub>8</sub> ) - Q' - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - N ( R<sub>8</sub> ) - 、
- O - C ( R<sub>6</sub> ) - N ( R<sub>8</sub> ) - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - N ( O R<sub>9</sub> ) - 、

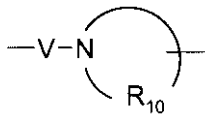
10

【化2】



、および

20



からなる群から選択され、

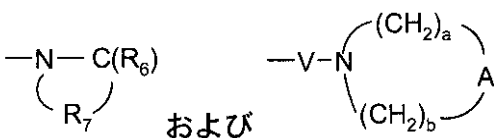
R<sub>4</sub>は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニルからなる群から選択され、ここで前記アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニル基は、非置換でもまたは独立して、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、アリール、アリールオキシ、アリールアルキレンオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキレンオキシ、ヘテロシクリル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、(ジアルキルアミノ)アルキレンオキシ、そしてアルキル、アルケニル、およびアルキニルの場合は、さらにオキソからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されていることもでき、

30

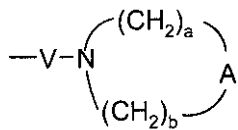
40

R<sub>5</sub>は

【化3】



、および



からなる群から選択され、

50

$R_6$  は = O および = S からなる群から選択され、  
 $R_7$  は  $C_{2-7}$  アルキレンであり、  
 $R_8$  は水素、アルキル、アルコキシアルキレニル、およびアリールアルキレニルからなる群から選択され、  
 $R_9$  は水素およびアルキルからなる群から選択され、  
 $R_{10}$  は  $C_{3-8}$  アルキレンであり、  
 $A$  は - O - 、 - C ( O ) - 、 - S ( O )<sub>0-2</sub> - 、 - CH<sub>2</sub> - 、 および - N ( R<sub>4</sub> ) - からなる群から選択され、  
 $Q'$  は結合、 - C ( R<sub>6</sub> ) - 、 - C ( R<sub>6</sub> ) - C ( R<sub>6</sub> ) - 、 - S ( O )<sub>2</sub> - 、 および - S ( O )<sub>2</sub> - N ( R<sub>8</sub> ) - からなる群から選択され、  
 $V$  は - C ( R<sub>6</sub> ) - 、 - O - C ( R<sub>6</sub> ) - 、 および - S ( O )<sub>2</sub> - からなる群から選択され、

10

$a$  および  $b$  は独立して 1 ~ 6 の整数であるが、ただし  $a + b$  は 7 であり、  
 $R_A$  および  $R_B$  はそれぞれ独立して、  
 水素、

ハロゲン、  
 アルキル、  
 アルケニル、  
 アルコキシ、  
 アルキルチオ、 および  
 - N ( R<sub>9</sub> )<sub>2</sub>

20

からなる群から選択され、

または  $R_A$  および  $R_B$  は一緒になって非置換のまたは 1 つ以上の R 基によって置換された縮合アリール環、或いは非置換のまたは 1 つ以上の R<sub>a</sub> 基によって置換された縮合飽和 5 ~ 7 員環のいずれかを形成し、

$R$  は、  
 フルオロ、  
 アルキル、  
 ハロアルキル、  
 アルコキシ、 および  
 - N ( R<sub>9</sub> )<sub>2</sub>

30

からなる群から選択され、

$R_a$  は、  
 ハロゲン、  
 ヒドロキシ、  
 アルキル、  
 アルケニル、  
 ハロアルキル、  
 アルコキシ、  
 アルキルチオ、 および  
 - N ( R<sub>9</sub> )<sub>2</sub>

40

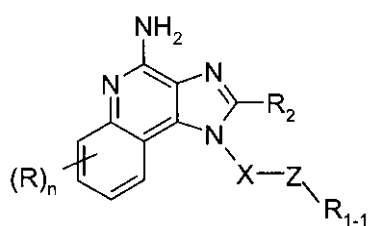
からなる群から選択される }

の化合物、またはその薬学上許容可能な塩。

【請求項 2】

以下の式 ( I - 2 ) :

## 【化 4】



I-2

10

{ 式中、

X は任意に 1 つ以上の - O - 基によって中断されるアルキレンであり、

n は 0 ~ 4 の整数であり、

Z は - C ( O ) - 、 - C ( O ) O - 、または - C ( - Q - R<sub>1-3</sub> )<sub>2</sub> - であり、R<sub>1-1</sub> は、

水素、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

- NH - S O<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、- NH - C ( O ) - R<sub>1-4</sub>、- NH - C ( O ) - N H<sub>2</sub>、- NH - C ( O ) - N H - R<sub>1-4</sub>、および- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択されるが、

ただし Z が - C ( O ) - であれば R<sub>1-1</sub> は - N ( C H<sub>3</sub> ) ( O C H<sub>3</sub> ) であってもよく、さらにただし Z が - C ( O ) O - であれば R<sub>1-1</sub> は水素でなく、

さらにただし Z が - C ( O ) O - であれば X は - O - 基を含まず、

Q は O または S であり、

R<sub>1-3</sub> は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

20

30

40

50

ハロゲン、  
シアノ、  
ニトロ、  
アルコキシ、  
ジアルキルアミノ、  
アルキルチオ、  
ハロアルキル、  
ハロアルコキシ、  
アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、

- NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および

- N<sub>3</sub>

10

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン-アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン-ヘテロアリールからなる群から選択され、

またはR<sub>1-3</sub>基は一緒になって飽和または不飽和5-、6-、または7-員環を含んでなる環系を形成でき、

R<sub>1-4</sub>は、

アルキル、

アリール、

アルキレン-アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン-ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、および

- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン-アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン-ヘテロアリールからなる群から選択され、そして

Rは、

フルオロ、

アルキル、

ハロアルキル、

アルコキシ、および

- N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>

からなる群から選択され、

R<sub>2</sub>は、

- R<sub>4</sub>、

- X' - R<sub>4</sub>、

- X' - Y' - R<sub>4</sub>、および

- X' - R<sub>5</sub>

20

30

40

50

からなる群から選択され、

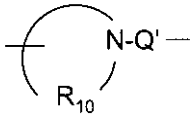
X' はアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アリーレン、およびヘテロアリーレンからなる群から選択され、ここで前記アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレン基は任意にアリーレンまたはヘテロアリーレンによって中断または終端されることができ、任意に1つ以上の-O-基によって中断され、

Y' は、

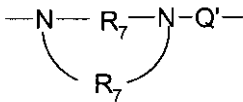
- S ( O )<sub>0-2</sub> - 、
- S ( O )<sub>2</sub> - N ( R<sub>8</sub> ) - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - O - 、
- O - C ( R<sub>6</sub> ) - 、
- O - C ( O ) - O - 、
- N ( R<sub>8</sub> ) - Q' - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - N ( R<sub>8</sub> ) - 、
- O - C ( R<sub>6</sub> ) - N ( R<sub>8</sub> ) - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - N ( O R<sub>9</sub> ) - 、

10

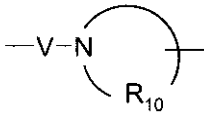
【化5】



20



、および



30

からなる群から選択され、

R<sub>4</sub> は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニルからなる群から選択され、ここで前記アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニル基は、非置換でもまたは独立してアルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、アリール、アリールオキシ、アリールアルキレンオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキレンオキシ、ヘテロシクリル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、(ジアルキルアミノ)アルキレンオキシ、そしてアルキル、アルケニル、およびアルキニルの場合は、さらにオキソからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されていることもでき、

40

R<sub>5</sub> は



ジアルキルアミノ、  
アルキルチオ、  
ハロアルキル、  
ハロアルコキシ、  
アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、
- NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、
- NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、
- NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および
- N<sub>3</sub>

10

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択されるが、

ただしZが - C(O) - であればR<sub>1-1</sub>は - N(CH<sub>3</sub>)(OCH<sub>3</sub>)であってもよく、  
さらにただしZが - C(O)O - であればR<sub>1-1</sub>は水素でなく、  
さらにただしZが - C(O)O - であればXは - O - 基を含まず、

QはOまたはSであり、

R<sub>1-3</sub>は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、
- NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、
- NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、
- NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および
- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、

またはR<sub>1-3</sub>基は一緒になって飽和または不飽和5 - 、6 - 、または7 - 員環を含んでなる環系を形成でき、

R<sub>1-4</sub>は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

40

50

ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、および  
 $-N_3$

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
 アルキレン-アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン-ヘテロアリールからなる群  
 から選択され、そして 10

$R_2$ は、

- $R_4$ 、
- $X' - R_4$ 、
- $X' - Y' - R_4$ 、および
- $X' - R_5$

からなる群から選択され、

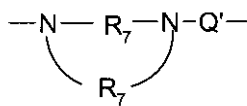
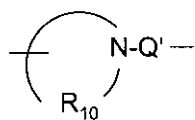
$X'$ はアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アリーレン、およびヘテロアリーレン  
 からなる群から選択され、ここで前記アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレン基  
 は任意にアリーレンまたはヘテロアリーレンによって中断または終端されることができ、  
 任意に1つ以上の-O-基によって中断され、 20

$Y'$ は、

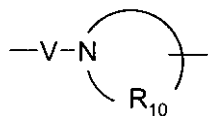
- $S(O)_{0-2}$  -、
- $S(O)_2 - N(R_8) -$ 、
- $C(R_6) -$ 、
- $C(R_6) - O -$ 、
- $O - C(R_6) -$ 、
- $O - C(O) - O -$ 、
- $N(R_8) - Q' -$ 、
- $C(R_6) - N(R_8) -$ 、
- $O - C(R_6) - N(R_8) -$ 、
- $C(R_6) - N(OR_9) -$ 、

30

【化8】



、および



40

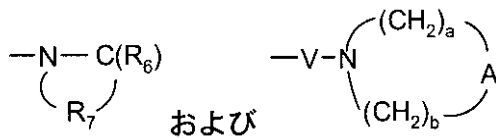
からなる群から選択され、

$R_4$ は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、ア  
 リールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールア 50

ルキレニル、ヘテロアリーロキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニルからなる群から選択され、ここで前記アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリーロキシアルキレニル、アリーロキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリーロキシアルキレニル、ヘテロアリーロキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニル基は、非置換でもまたは独立してアルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、アリール、アリーロキシ、アリーロキシアルキレンオキシ、ヘテロアリーロキシ、ヘテロアリーロキシアルキレンオキシ、ヘテロシクリル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、(ジアルキルアミノ)アルキレンオキシ、そしてアルキル、アルケニル、およびアルキニルの場合は、さらにオキソからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されていることもでき、

R<sub>5</sub>は

【化9】



からなる群から選択され、

R<sub>6</sub>は = O および = S からなる群から選択され、

R<sub>7</sub>は C<sub>2-7</sub>アルキレンであり、

R<sub>8</sub>は水素、アルキル、アルコキシアルキレニル、およびアリーロキシアルキレニルからなる群から選択され、

R<sub>9</sub>は水素およびアルキルからなる群から選択され、

R<sub>10</sub>は C<sub>3-8</sub>アルキレンであり、

Aは - O -、- C ( O ) -、- S ( O )<sub>0-2</sub> -、- CH<sub>2</sub> -、および - N ( R<sub>4</sub> ) - からなる群から選択され、

Q'は結合、- C ( R<sub>6</sub> ) -、- C ( R<sub>6</sub> ) - C ( R<sub>6</sub> ) -、- S ( O )<sub>2</sub> -、および - S ( O )<sub>2</sub> - N ( R<sub>8</sub> ) - からなる群から選択され、

Vは - C ( R<sub>6</sub> ) -、- O - C ( R<sub>6</sub> ) -、および - S ( O )<sub>2</sub> - からなる群から選択され、

a および b は独立して 1 ~ 6 の整数であるが、ただし a + b は 7 であり、

R<sub>A</sub> および R<sub>B</sub> はそれぞれ独立して、

水素、

ハロゲン、

アルキル、

アルケニル、

アルコキシ、

アルキルチオ、および

- N ( R<sub>9</sub> )<sub>2</sub>

からなる群から選択される }

の化合物またはその薬学上許容可能な塩。

【請求項4】

以下の式 ( I - 4 ) :

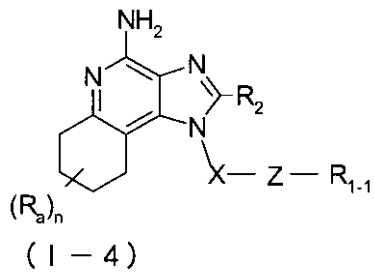
10

20

30

40

## 【化 1 0】



10

{ 式中、

X は任意に 1 つ以上の - O - 基によって中断されるアルキレンであり、

n は 0 ~ 4 の整数であり、

Z は - C ( O ) - 、 - C ( O ) O - 、または - C ( - Q - R<sub>1-3</sub> )<sub>2</sub> - であり、

R<sub>1-1</sub> は、

水素、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

- NH - S O<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C ( O ) - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C ( O ) - N H<sub>2</sub>、

- NH - C ( O ) - N H - R<sub>1-4</sub>、および

- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択されるが、

ただし Z が - C ( O ) - であれば R<sub>1-1</sub> は - N ( C H<sub>3</sub> ) ( O C H<sub>3</sub> ) であってもよく、

さらにただし Z が - C ( O ) O - であれば R<sub>1-1</sub> は水素でなく、

さらにただし Z が - C ( O ) O - であれば X は - O - 基を含まず、

Q は O または S であり、

R<sub>1-3</sub> は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

20

30

40

50

ハロゲン、  
シアノ、  
ニトロ、  
アルコキシ、  
ジアルキルアミノ、  
アルキルチオ、  
ハロアルキル、  
ハロアルコキシ、  
アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、

- NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および

- N<sub>3</sub>

10

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン-アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン-ヘテロアリールからなる群から選択され、

またはR<sub>1-3</sub>基は一緒になって飽和または不飽和5-、6-、または7-員環を含んでなる環系を形成でき、

R<sub>1-4</sub>は、

アルキル、

アリール、

アルキレン-アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン-ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、および

- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン-アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン-ヘテロアリールからなる群から選択され、そして

R<sub>a</sub>は、

ハロゲン、

ヒドロキシ、

アルキル、

アルケニル、

ハロアルキル、

アルコキシ、

アルキルチオ、および

- N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>

からなる群から選択され、

R<sub>2</sub>は、

- R<sub>4</sub>、

20

30

40

50

- X' - R<sub>4</sub>、
- X' - Y' - R<sub>4</sub>、および
- X' - R<sub>5</sub>

からなる群から選択され、

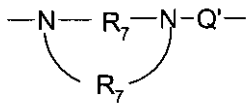
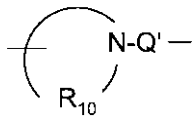
X' はアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アリーレン、およびヘテロアリーレンからなる群から選択され、ここで前記アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレン基は任意にアリーレンまたはヘテロアリーレンによって中断または終端されることができ、任意に1つ以上の - O - 基によって中断され、

Y' は、

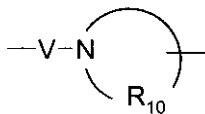
- S(O)<sub>0-2</sub> - 、
  - S(O)<sub>2</sub> - N(R<sub>8</sub>) - 、
  - C(R<sub>6</sub>) - 、
  - C(R<sub>6</sub>) - O - 、
  - O - C(R<sub>6</sub>) - 、
  - O - C(O) - O - 、
  - N(R<sub>8</sub>) - Q' - 、
  - C(R<sub>6</sub>) - N(R<sub>8</sub>) - 、
  - O - C(R<sub>6</sub>) - N(R<sub>8</sub>) - 、
  - C(R<sub>6</sub>) - N(OR<sub>9</sub>) - 、
- 【化11】

10

20



、および



30

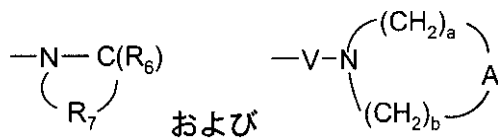
からなる群から選択され、

R<sub>4</sub> は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニルからなる群から選択され、ここで前記アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニル基は、非置換でもまたは独立してアルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、アリール、アリールオキシ、アリールアルキレンオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキレンオキシ、ヘテロシクリル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、(ジアルキルアミノ)アルキレンオキシ、そしてアルキル、アルケニル、およびアルキニルの場合は、さらにオキソからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されていることもでき、

40

R<sub>5</sub> は

## 【化 1 2】



からなる群から選択され、

$R_6$  は = O および = S からなる群から選択され、

$R_7$  は  $C_{2-7}$  アルキレンであり、

$R_8$  は水素、アルキル、アルコキシアルキレニル、およびアリアルキレニルからなる群から選択され、

$R_9$  は水素およびアルキルからなる群から選択され、

$R_{10}$  は  $C_{3-8}$  アルキレンであり、

A は - O - 、 - C ( O ) - 、 - S ( O )  $_{0-2}$  - 、 - CH $_2$  - 、 および - N ( R $_4$  ) - からなる群から選択され、

Q' は結合、 - C ( R $_6$  ) - 、 - C ( R $_6$  ) - C ( R $_6$  ) - 、 - S ( O )  $_2$  - 、 および - S ( O )  $_2$  - N ( R $_8$  ) - からなる群から選択され、

V は - C ( R $_6$  ) - 、 - O - C ( R $_6$  ) - 、 および - S ( O )  $_2$  - からなる群から選択され、

、そして

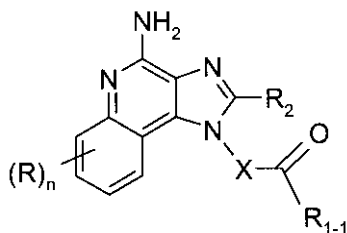
a および b は独立して 1 ~ 6 の整数であるが、ただし a + b は 7 である }

の化合物またはその薬学上許容可能な塩。

## 【請求項 5】

以下の式 ( I a ) :

## 【化 1 3】



I a

{ 式中、

X は任意に 1 つ以上の - O - 基によって中断されるアルキレンであり、

n は 0 ~ 4 の整数であり、

$R_{1-1}$  は、

水素、

アルキル、

アリアル、

アルキレン - アリアル、

ヘテロアリアル、

アルキレン - ヘテロアリアル、

- N ( CH $_3$  ) ( OCH $_3$  ) 、 並びに

ハロゲン、

シアノ、

10

20

30

40

50

ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、  
 - NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および  
 - N<sub>3</sub>

10

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
 アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群  
 から選択され、

R<sub>1-4</sub>は、  
 アルキル、  
 アリール、  
 アルキレン - アリール、  
 ヘテロアリール、

20

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、  
 シアノ、  
 ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、および

30

- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
 アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群  
 から選択され、

Rは、  
 フルオロ、  
 アルキル、  
 ハロアルキル、  
 アルコキシ、および

40

- N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>

からなる群から選択され、

R<sub>2</sub>は、  
 水素、  
 アルキル、  
 アルケニル、  
 アリール、  
 ヘテロアリール、  
 ヘテロシクリル、

アルキレン - Y - アルキル、  
 アルキレン - Y - アルケニル、

50

アルキレン - Y - アリール、並びに

ヒドロキシ、

ハロゲン、

- N ( R<sub>3</sub> )<sub>2</sub>、

- C ( O ) - C<sub>1-10</sub>アルキル、

- C ( O ) - O - C<sub>1-10</sub>アルキル、

- N ( R<sub>3</sub> ) - C ( O ) - C<sub>1-10</sub>アルキル、

- N<sub>3</sub>、

アリール、

ヘテロアリール、

ヘテロシクリル、

- C ( O ) - アリール、および

- C ( O ) - ヘテロアリール

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキルまたはアルケニルからなる群から選択され、

Y は - O - または - S ( O )<sub>0-2</sub> - であり、

R<sub>3</sub> は、

水素、

C<sub>1-10</sub>アルキル、および

C<sub>2-10</sub>アルケニル

からなる群から選択され、そして

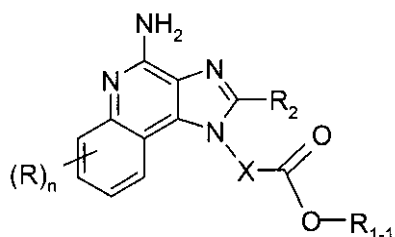
R<sub>9</sub> は水素およびアルキルからなる群から選択される }

の化合物またはその薬学上許容可能な塩。

【請求項 6】

以下の式 ( I b ) :

【化 1 4】



I b

{ 式中、

X はアルキレンであり、

n は 0 ~ 4 の整数であり、

R<sub>1-1</sub> は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

10

20

30

40

50

ジアルキルアミノ、  
アルキルチオ、  
ハロアルキル、  
ハロアルコキシ、  
アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、
- NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、
- NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、
- NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および
- N<sub>3</sub>

10

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sub>1-4</sub>は、  
アルキル、  
アリール、  
アルキレン - アリール、  
ヘテロアリール、  
アルキレン - ヘテロアリール、並びに

20

ハロゲン、  
シアノ、  
ニトロ、  
アルコキシ、  
ジアルキルアミノ、  
アルキルチオ、  
ハロアルキル、  
ハロアルコキシ、  
アルキル、および

- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、

30

Rは、  
フルオロ、  
アルキル、  
アルコキシ、  
ハロアルキル、および

- N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>

からなる群から選択され、

40

R<sub>2</sub>は、  
水素、  
アルキル、  
アルケニル、  
アリール、  
ヘテロアリール、  
ヘテロシクリル、  
アルキレン - Y - アルキル、  
アルキレン - Y - アルケニル、  
アルキレン - Y - アリール、並びに

- ヒドロキシ、

50

ハロゲン、  
 - N ( R<sub>3</sub> )<sub>2</sub>、  
 - C ( O ) - C<sub>1-10</sub>アルキル、  
 - C ( O ) - O - C<sub>1-10</sub>アルキル、  
 - N ( R<sub>3</sub> ) - C ( O ) - C<sub>1-10</sub>アルキル、  
 - N<sub>3</sub>、

アリール、

ヘテロアリール、

ヘテロシクリル、

- C ( O ) - アリール、および

- C ( O ) - ヘテロアリール

10

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキルまたはアルケニルからなる群から選択され、

Yは - O - または - S ( O )<sub>0-2</sub> - であり、

R<sub>3</sub>は、

水素、

C<sub>1-10</sub>アルキル、および

C<sub>2-10</sub>アルケニル

からなる群から選択され、そして

R<sub>9</sub>は水素およびアルキルからなる群から選択される }

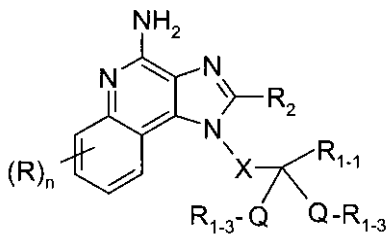
の化合物またはその薬学上許容可能な塩。

20

【請求項7】

以下の式 ( I d ) :

【化15】



30

I d

{ 式中、

Xは任意に1つ以上の - O - 基によって中断されるアルキレンであり、

nは0 ~ 4の整数であり、

R<sub>1-1</sub>は、

水素、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

40

50

アルキルチオ、  
ハロアルキル、  
ハロアルコキシ、  
アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、
- NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、
- NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、
- NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および
- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群  
から選択され、

QはOまたはSであり、

R<sub>1-3</sub>は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、

- NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および

- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群  
から選択され、

またはR<sub>1-3</sub>基は一緒になって飽和または不飽和5 - 、6 - 、または7 - 員環を含んでな  
る環系を形成でき、

R<sub>1-4</sub>は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

10

20

30

40

50

ハロアルキル、  
ハロアルコキシ、  
アルキル、および  
- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン-アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン-ヘテロアリールからなる群から選択され、

R は、  
フルオロ、  
アルキル、  
アルコキシ、  
ハロアルキル、および  
- N ( R<sub>9</sub> )<sub>2</sub>

からなる群から選択され、

R<sub>2</sub> は、  
水素、  
アルキル、  
アルケニル、  
アリール、  
ヘテロアリール、  
ヘテロシクリル、  
アルキレン - Y - アルキル、  
アルキレン - Y - アルケニル、  
アルキレン - Y - アリール、並びに

ヒドロキシ、  
ハロゲン、  
- N ( R<sub>3</sub> )<sub>2</sub>、  
- C ( O ) - C<sub>1-10</sub>アルキル、  
- C ( O ) - O - C<sub>1-10</sub>アルキル、  
- N ( R<sub>3</sub> ) - C ( O ) - C<sub>1-10</sub>アルキル、  
- N<sub>3</sub>、

アリール、  
ヘテロアリール、  
ヘテロシクリル、  
- C ( O ) - アリール、および  
- C ( O ) - ヘテロアリール

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキルまたはアルケニルからなる群から選択され、

Y は - O - または - S ( O )<sub>0-2</sub> - であり、そして

R<sub>3</sub> は、  
水素、  
C<sub>1-10</sub>アルキル、および  
C<sub>2-10</sub>アルケニル

からなる群から選択され、そして

R<sub>9</sub> は水素およびアルキルからなる群から選択される }  
の化合物またはその薬学上許容可能な塩。

【請求項 8】

以下の式 ( I e ) :

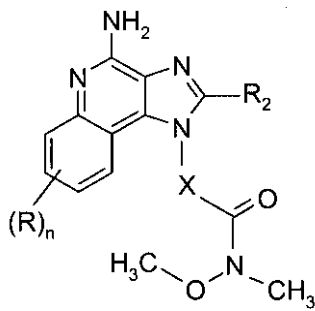
10

20

30

40

## 【化 16】



I e

10

20

30

40

50

(式中、  
 Xは任意に1つ以上の-O-基によって中断されるアルキレンであり、  
 nは0~4の整数であり、  
 Rは、  
 フルオロ、  
 アルキル、  
 アルコキシ、  
 ハロアルキル、および  
 -N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>  
 からなる群から選択され、  
 R<sub>2</sub>は、  
 水素、  
 アルキル、  
 アルケニル、  
 アリール、  
 ヘテロアリール、  
 ヘテロシクリル、  
 アルキレン-Y-アルキル、  
 アルキレン-Y-アルケニル、  
 アルキレン-Y-アリール、並びに  
 ヒドロキシ、  
 ハロゲン、  
 -N(R<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、  
 -C(O)-C<sub>1-10</sub>アルキル、  
 -C(O)-O-C<sub>1-10</sub>アルキル、  
 -N(R<sub>3</sub>)-C(O)-C<sub>1-10</sub>アルキル、  
 -N<sub>3</sub>、  
 アリール、  
 ヘテロアリール、  
 ヘテロシクリル、  
 -C(O)-アリール、および  
 -C(O)-ヘテロアリール  
 からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキルまたはアルケニルからなる群から選択され、  
 Yは-O-または-S(O)<sub>0-2</sub>-であり、そして  
 R<sub>3</sub>は、  
 水素、

$C_{1-10}$  アルキル、および

$C_{2-10}$  アルケニル

からなる群から選択され、そして

$R_9$  は水素およびアルキルからなる群から選択される }

の化合物またはその薬学上許容可能な塩。

【請求項 9】

$R_A$ 、および  $R_B$  が独立して、水素およびアルキルからなる群から選択される、請求項 3 に記載の化合物または塩。

【請求項 10】

$R_A$ 、および  $R_B$  がどちらもメチルである、請求項 9 に記載の化合物または塩。

10

【請求項 11】

$n$  が 0 である、請求項 2 または 4 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物または塩。

【請求項 12】

$Z$  が  $-C(O)-$  である、請求項 1 ~ 4、9、または 10、あるいは請求項 2 または 4 のいずれかに従属する請求項 11 のいずれか一項に記載の化合物または塩。

【請求項 13】

$Z$  が  $-C(O)O-$  である、請求項 1 ~ 4、9、または 10、あるいは請求項 2 または 4 のいずれかに従属する請求項 11 のいずれか一項に記載の化合物または塩。

【請求項 14】

$Z$  が  $-C(-Q-R_{1-3})_2-$  である、1 ~ 4、9、または 10、あるいは請求項 2 または 4 のいずれかに従属する請求項 11 のいずれか一項に記載の化合物または塩。

20

【請求項 15】

$R_{1-3}$  がアルキルであり、または  $R_{1-3}$  基が結合して 5 - 員環を形成する、請求項 14 に記載の化合物または塩。

【請求項 16】

$R_{1-3}$  の 5 -、6 -、または 7 - 員環が任意に 1 または 2 個の飽和または不飽和 5 -、6 -、または 7 - 員環に縮合し、或いはアリール、ヘテロアリール、ハロゲン、ハロアルキル、アルキレン - O - アルキル、および置換アリールからなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換される、請求項 14 に記載の化合物または塩。

【請求項 17】

各  $Q$  が  $-O-$  である、請求項 1 ~ 4、7、9、または 10、あるいは請求項 2、4、または 7 のいずれか一項に従属する請求項 11、あるいは請求項 14 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物または塩。

30

【請求項 18】

$R_{1-1}$  がアリール、アルキル、および  $-N(CH_3)OCH_3$  からなる群から選択される、請求項 1 ~ 5、9、または 10、あるいは請求項 2、4、または 5 のいずれか一項に従属する請求項 11、あるいは請求項 12 のいずれか一項に記載の化合物または塩。

【請求項 19】

$R_{1-1}$  がアルキル、アリール、および水素からなる群から選択される、請求項 1 ~ 5、7、9、10、あるいは請求項 2、4、5、または 7 のいずれか一項に従属する請求項 11、あるいは請求項 12、あるいは請求項 14 ~ 17 のいずれか一項に記載の化合物または塩。

40

【請求項 20】

$X$  が  $C_{1-6}$  アルキレンまたは  $-(CH_2)_{2-4}-O-(CH_2)_{1-3}-$  である、請求項 1 ~ 5、7 ~ 10、あるいは請求項 2、4、5、7、または 8 のいずれか一項に従属する請求項 11、あるいは請求項 12、あるいは請求項 14 ~ 19 のいずれか一項に記載の化合物または塩。

【請求項 21】

$X$  が  $-(CH_2)_{1-6}-$ 、 $-CH_2-C(CH_3)_2-$ 、 $-(CH_2)_2-O-CH_2-$ 、 $-(CH_2)_3-O-CH_2-$ 、および  $-CH_2-C(CH_3)_2-CH_2-$  からなる群から選択さ

50

れる、請求項 20 に記載の化合物または塩。

【請求項 22】

$R_{1-1}$  がアルキルおよびアリールからなる群から選択される、請求項 1 ~ 7、9、または 10 ; あるいは請求項 2、または 4 ~ 7 のいずれか一項に従属する請求項 11 ; あるいは請求項 12 ~ 19 ; あるいは請求項 1 ~ 5、7、9、10、または請求項 2、4、5、もしくは 7 のいずれか一項に従属する請求項 11、または請求項 14 ~ 19 のいずれか一項に従属する請求項 20 ; あるいは請求項 1 ~ 5、7、9、10、または請求項 2、4、5、もしくは 7 のいずれか一項に従属する請求項 11、または請求項 14 ~ 19 のいずれか一項に従属する請求項 21 のいずれか一項に記載の化合物または塩。

【請求項 23】

$R_{1-1}$  がメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、シクロペンチル、*n*-ヘキシル、シクロヘキシル、フェニル、4-クロロフェニル、および 2,4-ジクロロフェニルからなる群から選択される、請求項 22 に記載の化合物または塩。

【請求項 24】

$R_2$  が、

水素、

アルキル、

アルケニル、

アリール、

ヘテロアリール、

ヘテロシクリル、

アルキレン-Y-アルキル、

アルキレン-Y-アルケニル、

アルキレン-Y-アリール、並びに

ヒドロキシ、

ハロゲン、

-N( $R_3$ )<sub>2</sub>、

-C(O)-C<sub>1-10</sub>アルキル、

-C(O)-O-C<sub>1-10</sub>アルキル、

-N( $R_3$ )-C(O)-C<sub>1-10</sub>アルキル、

-N<sub>3</sub>、

アリール、

ヘテロアリール、

ヘテロシクリル、

-C(O)-アリール、および

-C(O)-ヘテロアリール

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキルまたはアルケニルからなる群から選択され、

Y が -O- または -S(O)<sub>0-2</sub>- であり、そして

$R_3$  が水素、C<sub>1-10</sub>アルキル、および C<sub>2-10</sub>アルケニルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 23 のいずれか一項に記載の化合物または塩。

【請求項 25】

$R_2$  が水素、アルキル、ヒドロキシアルキル、およびアルコキシアルキルからなる群から選択される、請求項 1 ~ 24 のいずれか一項に記載の化合物または塩。

【請求項 26】

$R_2$  が水素、ヒドロキシメチル、メチル、エチル、*n*-プロピル、*n*-ブチル、エトキシメチル、および 2-メトキシエチルからなる群から選択される、請求項 25 に記載の化合物または塩。

【請求項 27】

10

20

30

40

50

XがC<sub>1-6</sub>アルキレンである、請求項1～26のいずれか一項に記載の化合物または塩。

【請求項28】

Xが-(CH<sub>2</sub>)<sub>1-6</sub>-、-CH<sub>2</sub>-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-、および-CH<sub>2</sub>-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-からなる群から選択される、請求項27に記載の化合物または塩。

【請求項29】

治療的に有効量の請求項1～28のいずれか一項に記載の化合物または塩を薬学上許容可能なキャリアとの組み合わせで含んでなる、医薬組成物。

【請求項30】

有効量の請求項1～28のいずれか一項に記載の化合物または塩を動物に投与するステップを含んでなる、動物においてサイトカイン生合成を誘導する方法。

10

【請求項31】

請求項1～28のいずれか一項に記載の治療的に有効量の化合物または塩を動物に投与するステップを含んでなる、それを必要とする動物においてウイルス性疾患を処置する方法。

【請求項32】

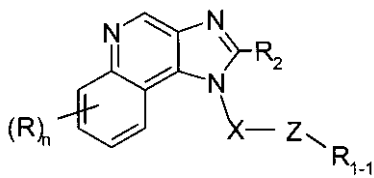
治療的に有効量の請求項1～28のいずれか一項に記載の化合物または塩を動物に投与するステップを含んでなる、新生物疾患の治療を必要とする動物において新生物疾患を治療する方法。

【請求項33】

20

以下の式(II)：

【化17】



II

30

{式中、

Xは任意に1つ以上の-O-基によって中断されるアルキレンであり、

nは0～4の整数であり、

Zは-C(O)-、-C(O)O-、または-C(-Q-R<sub>1-3</sub>)<sub>2</sub>-であり、

R<sub>1-1</sub>は、

水素、

アルキル、

アリール、

40

アルキレン-アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン-ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

50

ハロアルコキシ、  
アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、
- NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、
- NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、
- NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および
- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択されるが、

10

ただしZが - C(O) - であればR<sub>1-1</sub>は - N(CH<sub>3</sub>)(OCH<sub>3</sub>)であってもよく、  
さらにただしZが - C(O)O - であればR<sub>1-1</sub>は水素でなく、  
さらにただしZが - C(O)O - であればXは - O - 基を含まず、

QはOまたはSであり、

R<sub>1-3</sub>は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

20

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、

30

- NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、

- NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および

- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、

またはR<sub>1-3</sub>基は一緒になって飽和または不飽和5 - 、6 - 、または7 - 員環を含んでなる環系を形成でき、

R<sub>1-4</sub>は、

40

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

50

アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、および  
 - N<sub>3</sub>

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
 アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群  
 から選択され、

R は、  
 フルオロ、  
 アルキル、  
 アルコキシ、  
 ハロアルキル、および  
 - N ( R<sub>9</sub> )<sub>2</sub>

10

からなる群から選択され、  
 R<sub>2</sub> は、

水素、  
 アルキル、  
 アルケニル、  
 アリール、  
 ヘテロアリール、  
 ヘテロシクリル、  
 アルキレン - Y - アルキル、  
 アルキレン - Y - アルケニル、  
 アルキレン - Y - アリール、並びに

20

ヒドロキシ、  
 ハロゲン、  
 - N ( R<sub>3</sub> )<sub>2</sub>、  
 - C ( O ) - C<sub>1-10</sub> アルキル、  
 - C ( O ) - O - C<sub>1-10</sub> アルキル、  
 - N ( R<sub>3</sub> ) - C ( O ) - C<sub>1-10</sub> アルキル、  
 - N<sub>3</sub>、  
 アリール、  
 ヘテロアリール、  
 ヘテロシクリル、  
 - C ( O ) - アリール、および  
 - C ( O ) - ヘテロアリール

30

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキルまたはアルケ  
 ニルからなる群から選択され、

Y は - O - または - S ( O )<sub>0-2</sub> - であり、そして

40

R<sub>3</sub> は、  
 水素、  
 C<sub>1-10</sub> アルキル、および  
 C<sub>2-10</sub> アルケニル

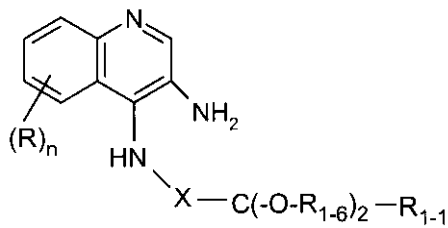
からなる群から選択され、そして

R<sub>9</sub> は水素およびアルキルからなる群から選択される }  
 の化合物またはその薬学上許容可能な塩。

【請求項 3 4】

以下の式 ( I I I ) :

## 【化 1 8】



| | |

10

{ 式中、

X は任意に 1 つ以上の - O - 基によって中断されるアルキレンであり、

n は 0 ~ 4 の整数であり、

R<sub>1-1</sub> は、

水素、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、- NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、- NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、- NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sub>1-6</sub> はアルキルであり、または R<sub>1-6</sub> 基は一緒になって飽和 5 - または 6 - 員環を含んでなる環系を形成でき、

R<sub>1-4</sub> は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

20

30

40

50

アルコキシ、  
ジアルキルアミノ、  
アルキルチオ、  
ハロアルキル、  
ハロアルコキシ、  
アルキル、および  
- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、

10

R は、  
フルオロ、  
アルキル、  
アルコキシ、  
ハロアルキル、および  
- N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>

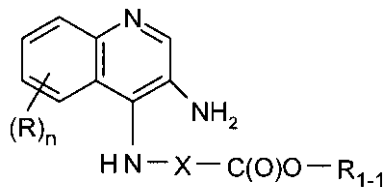
からなる群から選択され、そして  
R<sub>9</sub> は水素およびアルキルからなる群から選択される }  
の化合物またはその薬学上許容可能な塩。

20

【請求項 35】

以下の式 (IV) :

【化 19】



30

{ 式中、  
X はアルキレンであり、  
n は 0 ~ 4 の整数であり、  
R<sub>1-1</sub> は、  
アルキル、  
アリール、  
アルキレン - アリール、  
ヘテロアリール、  
アルキレン - ヘテロアリール、並びに  
ハロゲン、  
シアノ、  
ニトロ、  
アルコキシ、  
ジアルキルアミノ、  
アルキルチオ、  
ハロアルキル、  
ハロアルコキシ、  
アルキル、

40

50

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、
- NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、
- NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、
- NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および
- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン-アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン-ヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sub>1-4</sub>は、

アルキル、

アリール、

アルキレン-アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン-ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、および

- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン-アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン-ヘテロアリールからなる群から選択され、

Rは、

フルオロ、

アルキル、

アルコキシ、

ハロアルキル、および

- N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>

からなる群から選択され、そして

R<sub>9</sub>は水素およびアルキルからなる群から選択される}

の化合物またはその薬学上許容可能な塩。

【発明の詳細な説明】

【背景技術】

【0001】

関連出願の相互参照

本願は、2003年11月25日に出願された米国仮出願第60/524961号明細書、および2004年6月16日に出願された米国仮出願第60/580139号明細書の優先権の利益を主張し、どちらもその内容全体を本明細書に援用する。

【0002】

1950年代に、抗マラリア薬としての使用可能性のために、1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン環系が開発され、1-(6-メトキシ-8-キノリニル)-2-メチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリンが合成された。引き続き、様々な置換1H-イミダゾ[4,5-c]キノリンの合成が報告された。例えば可能な抗痙攣および心臓血管薬として1-[2-(4-ピペリジル)エチル]-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリンが合成された。いくつかの2-オキソイミダゾ[4,5-c]キノリンが報告されてい

10

20

30

40

50

る。

【0003】

特定の1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミンおよびそれらの1-および2-置換誘導体は、後に抗ウイルス剤、気管支拡張剤、および免疫調節物質として有用であることが判明した。引き続いて、特定の置換された1H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-4-アミン、キノリン-4-アミン、テトラヒドロキノリン-4-アミン、ナフチリジン-4-アミン、およびテトラヒドロナフチリジン-4-アミン化合物ならびに特定の類似のチアゾロおよびオキサゾロ化合物が合成され、免疫応答調節物質(I R M)として有用であることが分かり、それらは多様な疾患の処置において有用になった。

【0004】

イミダゾキノリン環系、およびその他の環系に対する継続的な関心があり、サイトカイン生合成またはその他の機序の誘導によって免疫応答を変調する能力を有する化合物に対する継続的な必要性がある。

【発明の概要】

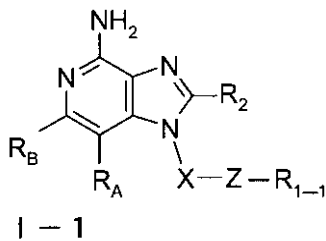
【課題を解決するための手段】

【0005】

本発明は、動物においてサイトカイン生合成を誘導するのに有用な新しいクラスの化合物を提供する。このような化合物は、

以下の式(I)：

【化1】



{ 式中、

Zは - C(O) -、- C(O)O -、または - C(-Q-R<sub>1-3</sub>)<sub>2</sub> - であり、

X、R<sub>A</sub>、R<sub>B</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>1-1</sub>、Q、およびR<sub>1-3</sub>については下で定義する}を有する。

【0006】

式I-1の化合物は、動物に投与されるとサイトカイン生合成を誘導する(例えば少なくとも1つのサイトカインの合成を誘導する)、およびその他のやり方で免疫応答を調節するそれらの能力のために免疫応答調節物質として有用である。これによって化合物は、免疫応答におけるこのような変化に反応するウイルス性疾患および腫瘍などの多様な病状の処置において有用になる。

【0007】

本発明は、有効量の式I-1の化合物を含有する医薬組成物を提供し、さらに有効量の式I-1の化合物を動物に投与することで、動物においてサイトカイン生合成を誘導し、動物においてウイルス性感染を処置するおよび/または新生物疾患を処置する方法を提供する。

【0008】

さらに式I-1の化合物、およびこれらの化合物の合成において有用な中間体を合成する方法が提供される。

【0009】

ここでの用法では、単数形(「a」、「an」、「the」)、「少なくとも1つ」および「1つ以上」は、区別なく使用される。

10

20

30

40

50

## 【 0 0 1 0 】

「含んでなる」という用語およびそのバリエーションが説明および特許請求の範囲に現れる場合、これらの用語は限定的意味を有さない。

## 【 0 0 1 1 】

上の本発明の概要は、それぞれの開示される実施態様またはあらゆる本発明の実行について述べることを意図しない。続く説明は例証的な実施態様をより詳しく例証する。本願明細書全体の数カ所において、実施例のリストを通じてガイダンスが提供され、その実施例は様々な組み合わせで使用できる。各例で列挙されるリストは、代表グループとしてのみの役目を果たし、排他的リストではないものとする。

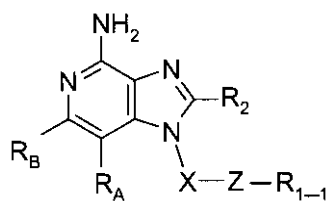
## 【 発明を実施するための形態 】

10

## 【 0 0 1 2 】

本発明は、  
以下の式 ( I - 1 ) :

## 【 化 2 】



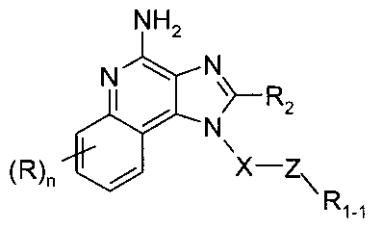
20

I - 1

{ 式中、

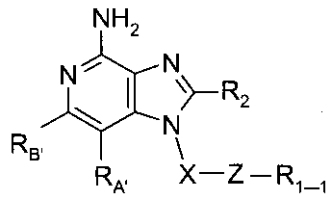
Z は - C ( O ) - 、 - C ( O ) O - 、または - C ( - Q - R<sub>1-3</sub> )<sub>2</sub> - である } の化合物、  
ならびに異なるコア環構造に相当するより具体的な式 ( I - 2 、 I - 3 、および I - 4 )

## 【化 3】



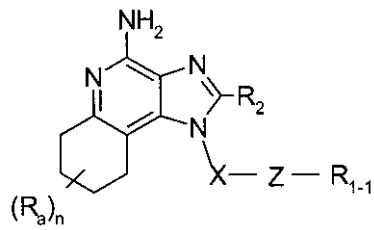
I - 2

10



I - 3

および

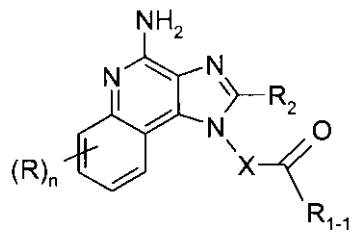


I - 4

20

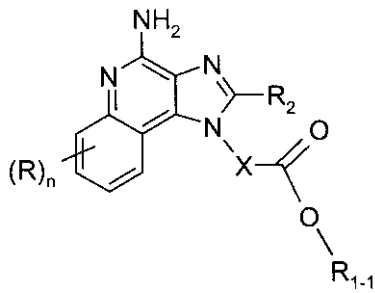
{ 式中、  
 $\text{Z}$  は  $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{O}-$ 、または  $-\text{C}(-\text{Q}-\text{R}_{1-3})_2-$  である } の化合物、  
 およびより具体的な式 ( I a、I b、I d、および I e )

## 【化4】



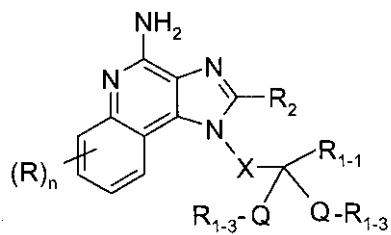
I a

10



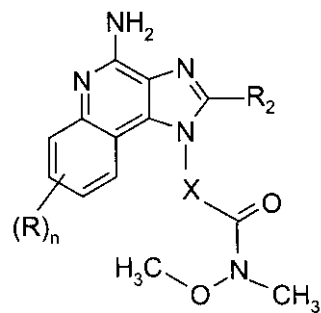
I b

20



I d

および



I e

30

{ 式中、

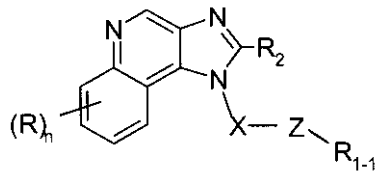
X、R、R<sub>a</sub>、R<sub>A</sub>、R<sub>B</sub>、R<sub>A'</sub>、R<sub>B'</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>1-1</sub>、Q、R<sub>1-3</sub>、およびnについては下で定義する } の化合物、およびその薬学上許容可能な塩を提供する。

40

## 【0013】

本発明はまた、  
式 ( I I 、 I I I 、 および I V )

## 【化5】

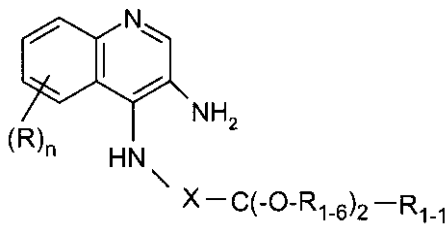


I I

10

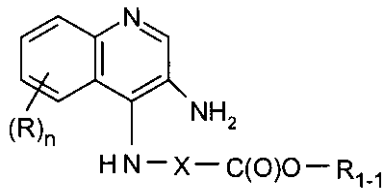
{ 式中、Zは - C ( O ) - 、 - C ( O ) O - 、または - C ( - Q - R<sub>1-3</sub> )<sub>2</sub> - である }

## 【化6】



I I I

および



I V

20

30

{ 式中、

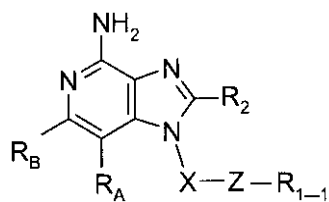
X、R、R<sub>2</sub>、R<sub>1-1</sub>、R<sub>1-6</sub>、Q、R<sub>1-3</sub>、およびnについては下で定義する } の化合物およびその薬学上許容可能な塩を提供する。

## 【0014】

—実施態様では、

以下の式 ( I - 1 ) :

## 【化7】



I - 1

40

{ 式中、

Xは任意に1つ以上の - O - 基によって中断されるアルキレンであり、

50

Zは - C ( O ) - 、 - C ( O ) O - 、または - C ( - Q - R<sub>1-3</sub> )<sub>2</sub> - であり、

R<sub>1-1</sub>は、

水素、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

- NH - S O<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C ( O ) - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C ( O ) - N H<sub>2</sub>、

- NH - C ( O ) - N H - R<sub>1-4</sub>、および

- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択されるが、

ただしZが - C ( O ) - であればR<sub>1-1</sub>は - N ( C H<sub>3</sub> ) ( O C H<sub>3</sub> ) であってもよく、

さらにただしZが - C ( O ) O - であればR<sub>1-1</sub>は水素でなく、

さらにただしZが - C ( O ) O - であればXは - O - 基を含まず、

QはOまたはSであり、

R<sub>1-3</sub>は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

- NH - S O<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C ( O ) - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C ( O ) - N H<sub>2</sub>、

- NH - C ( O ) - N H - R<sub>1-4</sub>、および

- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、

10

20

30

40

50

アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、

または  $R_{1-3}$  基は一緒になって飽和または不飽和 5 -、6 -、または 7 - 員環を含んでなる環系を形成でき、

$R_{1-4}$  は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、および

-  $N_3$

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、および

$R_2$  は、

-  $R_4$ 、

-  $X' - R_4$ 、

-  $X' - Y' - R_4$ 、および

-  $X' - R_5$

からなる群から選択され、

$X'$  はアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アリーレン、およびヘテロアリーレンからなる群から選択され、アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレン基は、アリーレンまたはヘテロアリーレンで任意に中断または終端されることができ、任意に 1 つ以上の - O - 基によって中断され、

$Y'$  は、

-  $S(O)_{0-2}$  -、

-  $S(O)_2 - N(R_8)$  -、

-  $C(R_6)$  -、

-  $C(R_6) - O$  -、

-  $O - C(R_6)$  -、

-  $O - C(O) - O$  -、

-  $N(R_8) - Q'$  -、

-  $C(R_6) - N(R_8)$  -、

-  $O - C(R_6) - N(R_8)$  -、

-  $C(R_6) - N(OR_9)$  -、

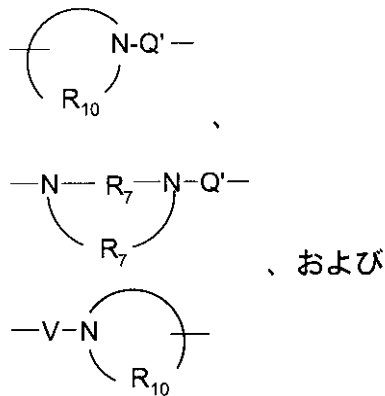
10

20

30

40

## 【化 8】



10

からなる群から選択され、

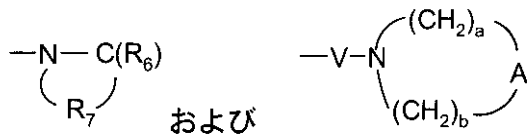
$R_4$  は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニルからなる群から選択され、ここで上記アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニル基は、非置換でも、または独立して、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、アリール、アリールオキシ、アリールアルキレンオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキレンオキシ、ヘテロシクリル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、(ジアルキルアミノ)アルキレンオキシ、そしてアルキル、アルケニル、およびアルキニルの場合は、さらにオキソからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されていることもでき、

20

30

$R_5$  は

## 【化 9】



からなる群から選択され、

$R_6$  は  $=O$  および  $=S$  からなる群から選択され、

$R_7$  は  $C_{2-7}$  アルキレンであり、

$R_8$  は水素、アルキル、アルコキシアルキレニル、およびアリールアルキレニルからなる群から選択され、

$R_9$  は水素およびアルキルからなる群から選択され、

$R_{10}$  は  $C_{3-8}$  アルキレンであり、

$A$  は  $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S(O)_{0-2}-$ 、 $-CH_2-$ 、および  $-N(R_4)-$  からなる群から選択され、

$Q'$  は結合、 $-C(R_6)-$ 、 $-C(R_6)-C(R_6)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、および  $-S(O)_2-N(R_8)-$  からなる群から選択され、

$V$  は  $-C(R_6)-$ 、 $-O-C(R_6)-$ 、および  $-S(O)_2-$  からなる群から選択され

40

50

、  
 a および b は独立して 1 ~ 6 の整数であるが、ただし a + b は 7 であり、  
 R<sub>A</sub> および R<sub>B</sub> はそれぞれ独立して、

水素、

ハロゲン、

アルキル、

アルケニル、

アルコキシ、

アルキルチオ、 および

- N ( R<sub>9</sub> )<sub>2</sub>

からなる群から選択され、

または R<sub>A</sub> および R<sub>B</sub> は一緒になって非置換のまたは 1 つ以上の R 基によって置換された縮合アリール環、または非置換のまたは 1 つ以上の R<sub>a</sub> 基によって置換された縮合飽和 5 ~ 7 員環のいずれかを形成し、

R は、

フルオロ、

アルキル、

ハロアルキル、

アルコキシ、 および

- N ( R<sub>9</sub> )<sub>2</sub>

からなる群から選択され、

R<sub>a</sub> は、

ハロゲン、

ヒドロキシ、

アルキル、

アルケニル、

ハロアルキル、

アルコキシ、

アルキルチオ、 および

- N ( R<sub>9</sub> )<sub>2</sub>

からなる群から選択される }

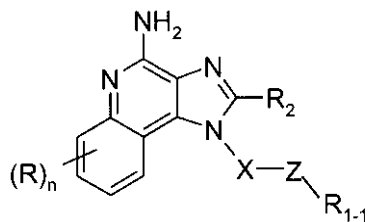
の化合物またはその薬学上許容可能な塩が提供される。

【 0 0 1 5 】

一実施態様では、

以下の式 ( I - 2 ) :

【 化 1 0 】



I - 2

{ 式中、

X は任意に 1 つ以上の - O - 基によって中断されるアルキレンであり、

n は 0 ~ 4 の整数であり、

Z は - C ( O ) - 、 - C ( O ) O - 、または - C ( - Q - R<sub>1-3</sub> )<sub>2</sub> - であり、

10

20

30

40

50

$R_{1-1}$ は、  
 水素、  
 アルキル、  
 アリール、  
 アルキレン - アリール、  
 ヘテロアリール、  
 アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、  
 シアノ、  
 ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、  
 - NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および  
 - N<sub>3</sub>

10

20

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
 アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群  
 から選択されるが、

ただしZが - C(O) - であれば  $R_{1-1}$  は - N(CH<sub>3</sub>)(OCH<sub>3</sub>) であってもよく、  
 さらにただしZが - C(O)O - であれば  $R_{1-1}$  は水素でなく、  
 さらにただしZが - C(O)O - であれば X は - O - 基を含まず、

QはOまたはSであり、

$R_{1-3}$ は、  
 アルキル、  
 アリール、  
 アルキレン - アリール、  
 ヘテロアリール、  
 アルキレン - ヘテロアリール；並びに

ハロゲン、  
 シアノ、  
 ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、  
 - NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および  
 - N<sub>3</sub>

30

40

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
 アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群

50

から選択され、

または  $R_{1-3}$  基は一緒になって飽和または不飽和 5 -、6 -、または 7 - 員環を含んでなる環系を形成でき、

$R_{1-4}$  は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、および

-  $N_3$

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、および

R は、

フルオロ、

アルキル、

ハロアルキル、

アルコキシ、および

-  $N(R_9)_2$

からなる群から選択され、

$R_2$  は、

-  $R_4$ 、

-  $X' - R_4$ 、

-  $X' - Y' - R_4$ 、および

-  $X' - R_5$

からなる群から選択され、

$X'$  はアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アリーレン、およびヘテロアリーレンからなる群から選択され、ここで上記アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレン基は、アリーレンまたはヘテロアリーレンで任意に中断または終端されることができ、任意に 1 つ以上の - O - 基によって中断され、

$Y'$  は、

-  $S(O)_{0-2}$  -、

-  $S(O)_2 - N(R_8)$  -、

-  $C(R_6)$  -、

-  $C(R_6) - O$  -、

-  $O - C(R_6)$  -、

-  $O - C(O) - O$  -、

-  $N(R_8) - Q'$  -、

-  $C(R_6) - N(R_8)$  -、

-  $O - C(R_6) - N(R_8)$  -、

-  $C(R_6) - N(OR_9)$  -、

10

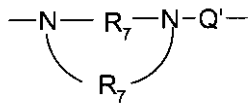
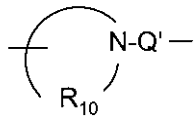
20

30

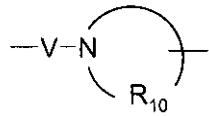
40

50

## 【化 1 1】



、および



10

からなる群から選択され、

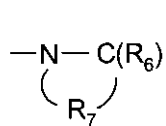
$R_4$ は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニルからなる群から選択され、ここで上記アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニル基は、非置換でもまたは独立して、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、アリール、アリールオキシ、アリールアルキレンオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキレンオキシ、ヘテロシクリル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、(ジアルキルアミノ)アルキレンオキシ、そしてアルキル、アルケニル、およびアルキニルの場合は、さらにオキソからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されていることもでき、

20

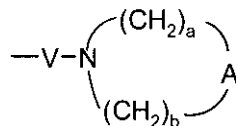
30

$R_5$ は

## 【化 1 2】



および



からなる群から選択され、

$R_6$ は = O および = S からなる群から選択され、

40

$R_7$ は  $C_{2-7}$ アルキレンであり、

$R_8$ は水素、アルキル、アルコキシアルキレニル、およびアリールアルキレニルからなる群から選択され、

$R_9$ は水素およびアルキルからなる群から選択され、

$R_{10}$ は  $C_{3-8}$ アルキレンであり、

Aは - O -、- C(O) -、- S(O)<sub>0-2</sub> -、- CH<sub>2</sub> -、および - N(R<sub>4</sub>) - からなる群から選択され、

Q'は結合、- C(R<sub>6</sub>) -、- C(R<sub>6</sub>) - C(R<sub>6</sub>) -、- S(O)<sub>2</sub> -、および - S(O)<sub>2</sub> - N(R<sub>8</sub>) からなる群から選択され、

Vは - C(R<sub>6</sub>) -、- O - C(R<sub>6</sub>) -、- N(R<sub>8</sub>) - C(R<sub>6</sub>) -、および - S(O)

50

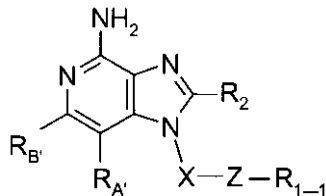
2 - からなる群から選択され、そして

a および b は独立して 1 ~ 6 の整数であるが、ただし a + b は 7 である } の化合物またはその薬学上許容可能な塩が提供される。

【 0 0 1 6 】

別の実施態様では、  
以下の式 ( I - 3 ) :

【 化 1 3 】



I - 3

10

{ 式中、

X は任意に 1 つ以上の - O - 基によって中断されるアルキレンであり、

Z は - C ( O ) - 、 - C ( O ) O - 、または - C ( - Q - R\_{1-3} )\_2 - であり、

20

R\_{1-1} は、

水素、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

30

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

- NH - S O\_2 - R\_{1-4}、

- NH - C ( O ) - R\_{1-4}、

- NH - C ( O ) - N H\_2、

- NH - C ( O ) - N H - R\_{1-4}、および

40

- N\_3

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択されるが、

ただし Z が - C ( O ) - であれば R\_{1-1} は - N ( C H\_3 ) ( O C H\_3 ) であってもよく、

さらにただし Z が - C ( O ) O - であれば R\_{1-1} は水素でなく、

さらにただし Z が - C ( O ) O - であれば X は - O - 基を含まず、

Q は O または S であり、

R\_{1-3} は、

アルキル、

50

アリール、  
アルキレン - アリール、  
ヘテロアリール、  
アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、  
シアノ、  
ニトロ、  
アルコキシ、  
ジアルキルアミノ、  
アルキルチオ、  
ハロアルキル、  
ハロアルコキシ、  
アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、  
- NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、  
- NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、  
- NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および  
- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群  
から選択され、

またはR<sub>1-3</sub>基は一緒になって飽和または不飽和5 - 、6 - 、または7 - 員環を含んでな  
る環系を形成でき、

R<sub>1-4</sub>は、  
アルキル、  
アリール、  
アルキレン - アリール、  
ヘテロアリール、  
アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、  
シアノ、  
ニトロ、  
アルコキシ、  
ジアルキルアミノ、  
アルキルチオ、  
ハロアルキル、  
ハロアルコキシ、  
アルキル、および

- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群  
から選択され、および

R<sub>2</sub>は、  
- R<sub>4</sub>、  
- X' - R<sub>4</sub>、  
- X' - Y' - R<sub>4</sub>、および  
- X' - R<sub>5</sub>

からなる群から選択され、

X'はアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アリーレン、およびヘテロアリーレン  
からなる群から選択され、ここで上記アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレン基

10

20

30

40

50

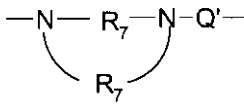
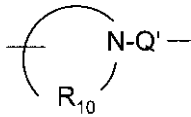
は、アリーレンまたはヘテロアリーレンで任意に中断または終端されることができ、任意に1つ以上の-O-基によって中断され、

Y' は、

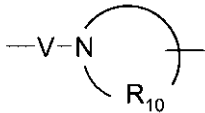
- S ( O )<sub>0-2</sub> - 、
- S ( O )<sub>2</sub> - N ( R<sub>8</sub> ) - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - O - 、
- O - C ( R<sub>6</sub> ) - 、
- O - C ( O ) - O - 、
- N ( R<sub>8</sub> ) - Q' - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - N ( R<sub>8</sub> ) - 、
- O - C ( R<sub>6</sub> ) - N ( R<sub>8</sub> ) - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - N ( O R<sub>9</sub> ) - 、

10

【化14】



および



20

からなる群から選択され、

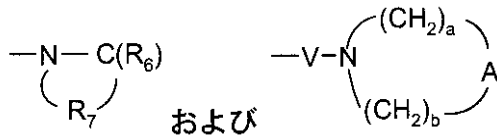
R<sub>4</sub>は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリーロキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリーロキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニルからなる群から選択され、ここで上記アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリーロキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリーロキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニル基は、非置換でもまたは独立して、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、アリール、アリーロキシ、アリールアルキレンオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリーロキシ、ヘテロアリールアルキレンオキシ、ヘテロシクリル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、(ジアルキルアミノ)アルキレンオキシ、そしてアルキル、アルケニル、およびアルキニルの場合は、さらにオキソからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されていることもでき、

30

40

R<sub>5</sub>は

## 【化15】



からなる群から選択され、

$R_6$  は  $=O$  および  $=S$  からなる群から選択され、

$R_7$  は  $C_{2-7}$  アルキレンであり、

$R_8$  は水素、アルキル、アルコキシアルキレニル、およびアリールアルキレニルからなる群から選択され、

$R_9$  は水素およびアルキルからなる群から選択され、

$R_{10}$  は  $C_{3-8}$  アルキレンであり、

A は  $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S(O)_{0-2}-$ 、 $-CH_2-$ 、および  $-N(R_4)-$  からなる群から選択され、

$Q'$  は結合、 $-C(R_6)-$ 、 $-C(R_6)-C(R_6)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、および  $-S(O)_2-N(R_8)-$  からなる群から選択され、

V は  $-C(R_6)-$ 、 $-O-C(R_6)-$ 、および  $-S(O)_2-$  からなる群から選択され

a および b は独立して 1 ~ 6 の整数であるが、ただし  $a + b$  は 7 であり、

$R_{A'}$  および  $R_{B'}$  はそれぞれ独立して、

水素、

ハロゲン、

アルキル、

アルケニル、

アルコキシ、

アルキルチオ、および

$-N(R_9)_2$

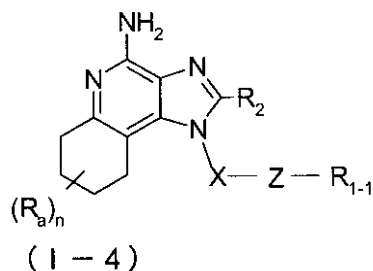
からなる群から選択される }

の化合物またはその薬学上許容可能な塩が提供される。

## 【0017】

別の実施態様では、以下の式 (I-4) :

## 【化16】



{ 式中、

X は任意に 1 つ以上の  $-O-$  基によって中断されるアルキレンであり、

n は 0 ~ 4 の整数であり、

Z は  $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、または  $-C(-Q-R_{1-3})_2-$  であり、

10

20

30

40

50

$R_{1-1}$ は、  
 水素、  
 アルキル、  
 アリール、  
 アルキレン - アリール、  
 ヘテロアリール、  
 アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、  
 シアノ、  
 ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、  
 - NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および  
 - N<sub>3</sub>

10

20

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
 アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群  
 から選択されるが、

ただしZが - C(O) - であれば  $R_{1-1}$ は - N(CH<sub>3</sub>)(OCH<sub>3</sub>) であってもよく、  
 さらにただしZが - C(O)O - であれば  $R_{1-1}$ は水素でなく、  
 さらにただしZが - C(O)O - であれば Xは - O - 基を含まず、

QはOまたはSであり、

$R_{1-3}$ は、  
 アルキル、  
 アリール、  
 アルキレン - アリール、  
 ヘテロアリール、  
 アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、  
 シアノ、  
 ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、  
 - NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および  
 - N<sub>3</sub>

30

40

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
 アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群

50

から選択され、

または  $R_{1-3}$  基は一緒になって飽和または不飽和 5 -、6 -、または 7 - 員環を含んでなる環系を形成でき、

$R_{1-4}$  は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、および

-  $N_3$

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、および

$R_a$  は、

ハロゲン、

ヒドロキシ、

アルキル、

アルケニル、

ハロアルキル、

アルコキシ、

アルキルチオ、および

-  $N(R_9)_2$

からなる群から選択され、

$R_2$  は、

-  $R_4$ 、

-  $X' - R_4$ 、

-  $X' - Y' - R_4$ 、および

-  $X' - R_5$

からなる群から選択され、

$X'$  はアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アリーレン、およびヘテロアリーレンからなる群から選択され、ここで上記アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレン基は、アリーレンまたはヘテロアリーレンで任意に中断または終端されることができ、任意に 1 つ以上の - O - 基によって中断され、

$Y'$  は、

-  $S(O)_{0-2}$  -、

-  $S(O)_2 - N(R_8)$  -、

-  $C(R_6)$  -、

-  $C(R_6) - O$  -、

-  $O - C(R_6)$  -、

-  $O - C(O) - O$  -、

-  $N(R_8) - Q'$  -、

10

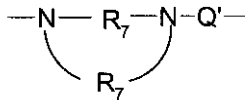
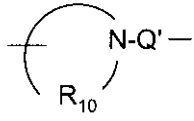
20

30

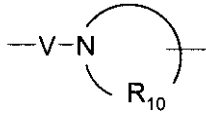
40

50

- C ( R<sub>6</sub> ) - N ( R<sub>8</sub> ) - 、
  - O - C ( R<sub>6</sub> ) - N ( R<sub>8</sub> ) - 、
  - C ( R<sub>6</sub> ) - N ( O R<sub>9</sub> ) - 、
- 【化 1 7】



、および



10

からなる群から選択され、

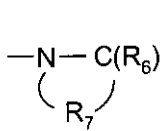
R<sub>4</sub>は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニルからなる群から選択され、ここで上記アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニル基は、非置換でも、または独立して、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、アリール、アリールオキシ、アリールアルキレンオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキレンオキシ、ヘテロシクリル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、(ジアルキルアミノ)アルキレンオキシ、そしてアルキル、アルケニル、およびアルキニルの場合は、さらにオキソからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されていることもでき、

20

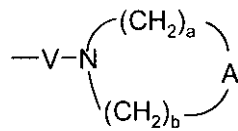
30

R<sub>5</sub>は

【化 1 8】



および



40

からなる群から選択され、

R<sub>6</sub>は = O および = S からなる群から選択され、

R<sub>7</sub>は C<sub>2-7</sub>アルキレンであり、

R<sub>8</sub>は水素、アルキル、アルコキシアルキレニル、およびアリールアルキレニルからなる群から選択され、

R<sub>9</sub>は水素およびアルキルからなる群から選択され、

R<sub>10</sub>は C<sub>3-8</sub>アルキレンであり、

Aは - O - 、 - C ( O ) - 、 - S ( O )<sub>0-2</sub> - 、 - C H<sub>2</sub> - 、 および - N ( R<sub>4</sub> ) - からなる群から選択され、

50

Q' は結合、 $-C(R_6)-$ 、 $-C(R_6)-C(R_6)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、および  $-S(O)_2-N(R_8)-$  からなる群から選択され、

V は  $-C(R_6)-$ 、 $-O-C(R_6)-$ 、および  $-S(O)_2-$  からなる群から選択され、そして

a および b は独立して 1 ~ 6 の整数であるが、ただし  $a + b = 7$  である }

の化合物またはその薬学上許容可能な塩が提供される。

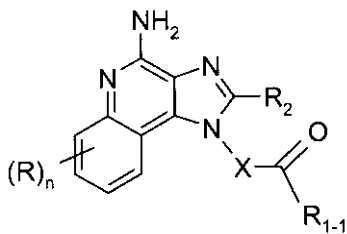
【0018】

別の実施態様では、

式 (I a)、

【化19】

10



I a

20

{ 式中、

X は任意に 1 つ以上の  $-O-$  基によって中断されるアルキレンであり、

n は 0 ~ 4 の整数であり、

$R_{1-1}$  は、

水素、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、

$-N(CH_3)(OCH_3)$ 、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

$-NH-SO_2-R_{1-4}$ 、

$-NH-C(O)-R_{1-4}$ 、

$-NH-C(O)-NH_2$ 、

$-NH-C(O)-NH-R_{1-4}$ 、および

$-N_3$

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、

$R_{1-4}$  は、

30

40

50

アルキル、  
 アリール、  
 アルキレン - アリール、  
 ヘテロアリール、  
 アルキレン - ヘテロアリール、並びに  
 ハロゲン、  
 シアノ、  
 ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、および  
 - N<sub>3</sub>

10

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
 アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群  
 から選択され、

R は、  
 フルオロ、  
 アルキル、  
 ハロアルキル、  
 アルコキシ、および  
 N ( R<sub>9</sub> )<sub>2</sub> からなる群から選択され、そして

20

R<sub>2</sub> は、  
 水素、  
 アルキル、  
 アルケニル、  
 アリール、  
 ヘテロアリール、  
 ヘテロシクリル、  
 アルキレン - Y - アルキル、  
 アルキレン - Y - アルケニル、  
 アルキレン - Y - アリール、並びに

30

ヒドロキシ、  
 ハロゲン、  
 - N ( R<sub>3</sub> )<sub>2</sub>、  
 - C ( O ) - C<sub>1-10</sub>アルキル、  
 - C ( O ) - O - C<sub>1-10</sub>アルキル、  
 - N ( R<sub>3</sub> ) - C ( O ) - C<sub>1-10</sub>アルキル、  
 - N<sub>3</sub>、  
 アリール、  
 ヘテロアリール、  
 ヘテロシクリル、  
 - C ( O ) - アリール、および  
 - C ( O ) - ヘテロアリール

40

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキルまたはアルケ  
 ニルからなる群から選択され、

Y は - O - または - S ( O )<sub>0-2</sub> - であり、および

R<sub>3</sub> は、

50

水素、

$C_{1-10}$  アルキル、および

$C_{2-10}$  アルケニル

からなる群から選択され、そして

$R_9$  は水素およびアルキルからなる群から選択される }

の化合物またはその薬学上許容可能な塩が提供される。

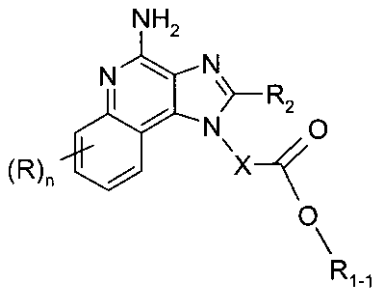
【 0 0 1 9 】

別の実施態様では、

以下の式 ( I b ) :

【 化 2 0 】

10



I b

20

{ 式中、

X はアルキレンであり、

n は 0 ~ 4 の整数であり、

$R_{1-1}$  は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C ( O ) - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C ( O ) - NH<sub>2</sub>、

- NH - C ( O ) - NH - R<sub>1-4</sub>、および

- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、

アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群

から選択され、

$R_{1-4}$  は、

アルキル、

30

40

50

アリール、  
 アルキレン - アリール、  
 ヘテロアリール、  
 アルキレン - ヘテロアリール、並びに  
 ハロゲン、  
 シアノ、  
 ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、および

10

-  $N_3$

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
 アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群  
 から選択され、

R は、  
 フルオロ、  
 アルキル、  
 アルコキシ、  
 ハロアルキル、および

20

-  $N(R_9)_2$

からなる群から選択され、および

$R_2$  は、  
 水素、  
 アルキル、  
 アルケニル、  
 アリール、

30

ヘテロアリール、  
 ヘテロシクリル、  
 アルキレン - Y - アルキル、  
 アルキレン - Y - アルケニル、  
 アルキレン - Y - アリール、並びに

ヒドロキシ、  
 ハロゲン、  
 -  $N(R_3)_2$ 、  
 -  $C(O) - C_{1-10}$ アルキル、  
 -  $C(O) - O - C_{1-10}$ アルキル、  
 -  $N(R_3) - C(O) - C_{1-10}$ アルキル、

40

-  $N_3$ 、  
 アリール、  
 ヘテロアリール、  
 ヘテロシクリル、  
 -  $C(O) -$ アリール、および  
 -  $C(O) -$ ヘテロアリール

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキルまたはアルケ  
 ニルからなる群から選択され、

Y は - O - または -  $S(O)_{0-2}$  - であり、および

$R_3$  は、

50

水素、

$C_{1-10}$  アルキル、および

$C_{2-10}$  アルケニル

からなる群から選択され、そして

$R_9$  は水素およびアルキルからなる群から選択される }

の化合物またはその薬学上許容可能な塩が提供される。

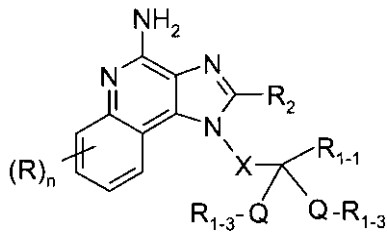
【 0 0 2 0 】

別の実施態様では、本発明は、

以下の式 ( I d ) :

【 化 2 1 】

10



I d

20

{ 式中、

X は任意に 1 つ以上の - O - 基によって中断されるアルキレンであり、

n は 0 ~ 4 の整数であり、

$R_{1-1}$  は、

水素、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C ( O ) - R<sub>1-4</sub>、

- NH - C ( O ) - NH<sub>2</sub>、

- NH - C ( O ) - NH - R<sub>1-4</sub>、および

- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、

アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群

から選択され、

Q は O または S であり、

$R_{1-3}$  は、

30

40

50

- アルキル、  
 アリール、  
 アルキレン - アリール、  
 ヘテロアリール、  
 アルキレン - ヘテロアリール、並びに  
 ハロゲン、  
 シアノ、  
 ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、  
 - NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、  
 - NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および  
 - N<sub>3</sub>
- からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
 アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群  
 から選択され、  
 または R<sub>1-3</sub> 基は一緒になって飽和または不飽和 5 -、6 -、または 7 - 員環を含んでな  
 る環系を形成でき、  
 R<sub>1-4</sub> は、  
 アルキル、  
 アリール、  
 アルキレン - アリール、  
 ヘテロアリール、  
 アルキレン - ヘテロアリール、並びに
- ハロゲン、  
 シアノ、  
 ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、および  
 - N<sub>3</sub>
- からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
 アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群  
 から選択され、  
 R は、  
 フルオロ、  
 アルキル、  
 アルコキシ、  
 ハロアルキル、および  
 - N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>
- からなる群から選択され、そして

10

20

30

40

50

R<sub>2</sub>は、  
 水素、  
 アルキル、  
 アルケニル、  
 アリール、  
 ヘテロアリール、  
 ヘテロシクリル、  
 アルキレン - Y - アルキル、  
 アルキレン - Y - アルケニル、  
 アルキレン - Y - アリール、並びに

10

ヒドロキシ、  
 ハロゲン、  
 - N ( R<sub>3</sub> )<sub>2</sub>、  
 - C ( O ) - C<sub>1-10</sub>アルキル、  
 - C ( O ) - O - C<sub>1-10</sub>アルキル、  
 - N ( R<sub>3</sub> ) - C ( O ) - C<sub>1-10</sub>アルキル、  
 - N<sub>3</sub>、

アリール、  
 ヘテロアリール、  
 ヘテロシクリル、

20

- C ( O ) - アリール、および  
 - C ( O ) - ヘテロアリール

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキルまたはアルケニルからなる群から選択され、

Yは - O - または - S ( O )<sub>0-2</sub> - であり、および

R<sub>3</sub>は、

水素、

C<sub>1-10</sub>アルキル、および

C<sub>2-10</sub>アルケニル

からなる群から選択され、そして

30

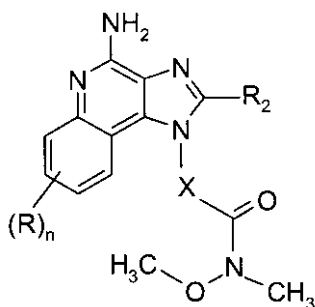
R<sub>9</sub>は水素およびアルキルからなる群から選択される }  
 の化合物またはその薬学上許容可能な塩を提供する。

【 0 0 2 1 】

別の実施態様では、

以下の式 ( I e ) :

【 化 2 2 】



I e

40

{ 式中、

Xは任意に1つ以上の - O - 基によって中断されるアルキレンであり、

50

n は 0 ~ 4 の整数であり、

R は、

フルオロ、

アルキル、

アルコキシ、

ハロアルキル、および

- N ( R<sub>9</sub> )<sub>2</sub>

からなる群から選択され、そして

R<sub>2</sub> は、

水素、

アルキル、

アルケニル、

アリール、

ヘテロアリール、

ヘテロシクリル、

アルキレン - Y - アルキル、

アルキレン - Y - アルケニル、

アルキレン - Y - アリール、並びに

ヒドロキシ、

ハロゲン、

- N ( R<sub>3</sub> )<sub>2</sub>、

- C ( O ) - C<sub>1-10</sub>アルキル、

- C ( O ) - O - C<sub>1-10</sub>アルキル、

- N ( R<sub>3</sub> ) - C ( O ) - C<sub>1-10</sub>アルキル、

- N<sub>3</sub>、

アリール、

ヘテロアリール、

ヘテロシクリル、

- C ( O ) - アリール、および

- C ( O ) - ヘテロアリール

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキルまたはアルケニルからなる群から選択され、

Y は - O - または - S ( O )<sub>0-2</sub> - であり、および

R<sub>3</sub> は、

水素、

C<sub>1-10</sub>アルキル、および

C<sub>2-10</sub>アルケニル

からなる群から選択され、そして

R<sub>9</sub> は水素およびアルキルからなる群から選択される }

の化合物またはその薬学上許容可能な塩が提供される。

【 0 0 2 2 】

別の実施態様では、

以下の式 ( I I ) :

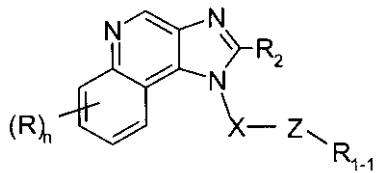
10

20

30

40

## 【化 2 3】



I I

10

{ 式中、

X は任意に 1 つ以上の - O - 基によって中断されるアルキレンであり、

n は 0 ~ 4 の整数であり、

Z は - C ( O ) - 、 - C ( O ) O - 、または - C ( - Q - R<sub>1-3</sub> )<sub>2</sub> - であり、R<sub>1-1</sub> は、

水素、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

- NH - S O<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、- NH - C ( O ) - R<sub>1-4</sub>、- NH - C ( O ) - N H<sub>2</sub>、- NH - C ( O ) - N H - R<sub>1-4</sub>、および- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択されるが、

ただし Z が - C ( O ) - であれば R<sub>1-1</sub> は - N ( C H<sub>3</sub> ) ( O C H<sub>3</sub> ) であってもよく、

さらにただし Z が - C ( O ) O - であれば R<sub>1-1</sub> は水素でなく、

さらにただし Z が - C ( O ) O - であれば X は - O - 基を含まず、

Q は O または S であり、

R<sub>1-3</sub> は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

50

シアノ、  
 ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、  
 - NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、  
 - NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および  
 - N<sub>3</sub>

10

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、

または R<sub>1-3</sub>基は一緒になって飽和または不飽和5 - 、6 - 、または7 - 員環を含んでなる環系を形成でき、

R<sub>1-4</sub>は、  
 アルキル、  
 アリール、  
 アルキレン - アリール、  
 ヘテロアリール、  
 アルキレン - ヘテロアリール、並びに

20

ハロゲン、  
 シアノ、  
 ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、および  
 - N<sub>3</sub>

30

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、

Rは、  
 フルオロ、  
 アルキル、  
 アルコキシ、  
 ハロアルキル、および  
 - N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>

40

からなる群から選択され、

R<sub>2</sub>は、  
 水素、  
 アルキル、  
 アルケニル、  
 アリール、  
 ヘテロアリール、

50

ヘテロシクリル、  
 アルキレン - Y - アルキル、  
 アルキレン - Y - アルケニル、  
 アルキレン - Y - アリール、並びに  
 ヒドロキシ、  
 ハロゲン、  
 - N ( R<sub>3</sub> )<sub>2</sub>、  
 - C ( O ) - C<sub>1-10</sub>アルキル、  
 - C ( O ) - O - C<sub>1-10</sub>アルキル、  
 - N ( R<sub>3</sub> ) - C ( O ) - C<sub>1-10</sub>アルキル、  
 - N<sub>3</sub>、  
 アリール、  
 ヘテロアリール、  
 ヘテロシクリル、  
 - C ( O ) - アリール、および  
 - C ( O ) - ヘテロアリール

10

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキルまたはアルケニルからなる群から選択され、

Yは - O - または - S ( O )<sub>0-2</sub>であり、および

20

R<sub>3</sub>は、

水素、

C<sub>1-10</sub>アルキル、および

C<sub>2-10</sub>アルケニル

からなる群から選択され、そして

R<sub>9</sub>は水素およびアルキルからなる群から選択される }

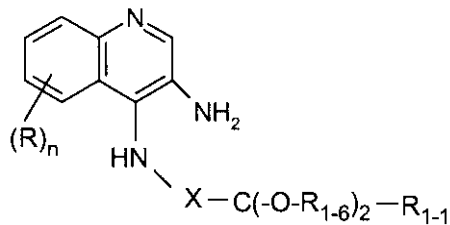
の化合物またはその薬学上許容可能な塩が提供される。

【 0 0 2 3 】

別の実施態様では、以下の式 ( I I I ) :

【 化 2 4 】

30



40

{ 式中、

Xは任意に1つ以上の - O - 基によって中断されるアルキレンであり、

nは0 ~ 4の整数であり、

R<sub>1-1</sub>は、

水素、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

50

ハロゲン、  
シアノ、  
ニトロ、  
アルコキシ、  
ジアルキルアミノ、  
アルキルチオ、  
ハロアルキル、  
ハロアルコキシ、  
アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、
- NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、
- NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、
- NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および
- N<sub>3</sub>

10

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sub>1-6</sub>はアルキルであり、またはR<sub>1-6</sub>基は一緒になって飽和5 - または6 - 員環を含んでなる環系を形成でき、

R<sub>1-4</sub>は、  
アルキル、  
アリール、  
アルキレン - アリール、  
ヘテロアリール、  
アルキレン - ヘテロアリール、並びに

20

ハロゲン、  
シアノ、  
ニトロ、  
アルコキシ、  
ジアルキルアミノ、  
アルキルチオ、  
ハロアルキル、  
ハロアルコキシ、  
アルキル、および

30

- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、

Rは、  
フルオロ、  
アルキル、  
アルコキシ、  
ハロアルキル、および

40

- N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>

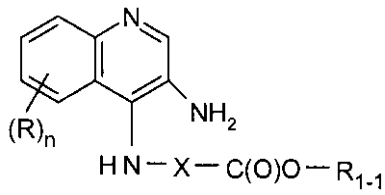
からなる群から選択され、そして

R<sub>9</sub>は水素およびアルキルからなる群から選択される } の化合物またはその薬学上許容可能な塩が提供される。

【0024】

別の実施態様では、以下の式(IV)：

## 【化 2 5】



10

{ 式中、  
 X はアルキレンであり、  
 n は 0 ~ 4 の整数であり、  
 R<sub>1-1</sub> は、  
 アルキル、  
 アリール、  
 アルキレン - アリール、  
 ヘテロアリール、  
 アルキレン - ヘテロアリール、並びに

20

ハロゲン、  
 シアノ、  
 ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、  
 - NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、  
 - NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および  
 - N<sub>3</sub>

30

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、  
 アルキレン - アリール、ヘテロアリール、または  
 アルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sub>1-4</sub> は、  
 アルキル、  
 アリール、  
 アルキレン - アリール、  
 ヘテロアリール、  
 アルキレン - ヘテロアリール、並びに

40

ハロゲン、  
 シアノ、  
 ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、

50

ハロアルコキシ、  
アルキル、および  
- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン-アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン-ヘテロアリールからなる群から選択され、

Rは、  
フルオロ、  
アルキル、  
アルコキシ、  
ハロアルキル、および  
- N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>

からなる群から選択され、そして

R<sub>9</sub>は水素およびアルキルからなる群から選択される }  
の化合物またはその薬学上許容可能な塩が提供される。

【0025】

ここでの用法では、「アルキル」、「アルケニル」、「アルキニル」という用語、および接頭辞「アルク-」は、直鎖および分枝鎖基の双方、および環式基、すなわちシクロアルキルおよびシクロアルケニルを包含する。特に断りのない限り、これらの基は1~20個の炭素原子を含有し、アルケニル基は2~20個の炭素原子を含有し、アルキニル基は2~20個の炭素原子を含有する。いくつかの実施態様では、これらの基は全部で10個までの炭素原子、8個までの炭素原子、6個までの炭素原子、または4個までの炭素原子を有する。環式基は単環式または多環式であることができ、好ましくは3~10個の環炭素原子を有する。例示的な環式基としては、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、アダマンチル、および置換または非置換のボルニル、ノルボルニル、およびノルボルネニルが挙げられる。

【0026】

特に断りのない限り、「アルキレン」、「アルケニレン」、および「アルキニレン」は、上で定義される「アルキル」、「アルケニル」、および「アルキニル」基の二価の形態である。「アルキレニル」、「アルケニレニル」、および「アルキニレニル」という用語は、「アルキレン」、「アルケニレン」、および「アルキニレン」がそれぞれ置換された場合に使用される。例えばアリールアルキレニル基は、アリール基が付着したアルキレン部分を含んでなる。

【0027】

「ハロアルキル」という用語は、過フッ素化基をはじめとする1つ以上のハロゲン原子によって置換された基を包含する。これはまた、接頭辞「ハロ-」を含むその他の基にも当てはまる。適切なハロアルキル基の例は、クロロメチル、トリフルオロメチルなどである。

【0028】

「アリール」という用語は、ここでの用法では、炭素環式芳香族環または環系を含む。アリール基の例としては、フェニル、ナフチル、ビフェニル、フルオレニルおよびインデニルが挙げられる。

【0029】

特に断りのない限り「ヘテロ原子」という用語は、原子O、S、またはNを指す。

【0030】

「ヘテロアリール」という用語は、少なくとも1つの環ヘテロ原子(例えばO、S、N)を含有する芳香族環または環系を含む。適切なヘテロアリール基としては、フリル、チエニル、ピリジル、キノリニル、イソキノリニル、インドリル、イソインドリル、トリアゾリル、ピロリル、テトラゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、カルバゾリル、ベンソオキサゾリル、ピリミ

10

20

30

40

50

ジニル、ベンソイミダゾリル、キノキサリニル、ベンゾチアゾリル、ナフチリジニル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、プリニル、キナゾリニル、ピラジニル、1-オキシドピリジル、ピリダジニル、トリアジニル、テトラジニル、オキサジアゾリル、チアアジアゾリルなどが挙げられる。

【0031】

「ヘテロシクリル」という用語は、少なくとも1つの環ヘテロ原子（例えばO、S、N）を含有する非芳香族環または環系を含み、上で言及されるヘテロアリール基の完全飽和および部分的不飽和誘導体の全てを含む。例示的なヘテロ環式基としては、ピロリジニル、テトラヒドロフラニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ペペリジニル、ペペラジニル、チアゾリジニル、イミダゾリジニル、イソチアゾリジニル、テトラヒドロピラニル、キヌクリジニル、ホモペペリジニル（アゼパニル）、ホモペペラジニル（ジアゼパニル）、1,3-ジオキサニル、アジリジニル、ジヒドロイソキノリン-(1H)-イル、オクタヒドロイソキノリン-(1H)-イル、ジヒドロキノリン-(2H)-イル、オクタヒドロキノリン-(2H)-イル、ジヒドロ-1H-イミダゾリルなどが挙げられる。「ヘテロシクリル」が窒素原子を含有する場合、ヘテロシクリル基の付着点は窒素原子であってもよい。

10

【0032】

「アリーレン」、「ヘテロアリーレン」、および「ヘテロシクリレン」という用語は、上で定義される「アリール」、「ヘテロアリール」、および「ヘテロシクリル」基の二価の形態である。「アリーレニル」、「ヘテロアリーレニル」、および「ヘテロシクリレニル」という用語は、「アリーレン」、「ヘテロアリーレン」、および「ヘテロシクリレン」がそれぞれ置換された場合に使用される。例えばアルキルアリーレニル基は、アルキル基が付着したアリーレン部分を含んでなる。

20

【0033】

化学基（または置換基または変数）が、ここで述べられるいずれかの式で1回を超えて存在する場合、各基（または置換基または変数）は、明示的に述べられるかどうかにかかわらず独立して選択される。例えば式-N(R<sub>3</sub>)<sub>2</sub>では、各R<sub>3</sub>基は独立して選択される。さらに別の例では、1つを超えるR<sub>1-3</sub>基が存在して各R<sub>1-3</sub>基が1つ以上のR<sub>1-4</sub>基を含有する場合、各R<sub>1-3</sub>基は独立して選択され、各R<sub>1-4</sub>基は独立して選択される。

30

【0034】

本発明は、ここで述べられる化合物を異性体（例えばジアステレオマーおよび鏡像異性体）、塩、溶媒和化合物、多形体などをはじめとするそれらのあらゆる薬学上許容可能な形態で包含する。特に化合物が光学活性である場合、本発明は、具体的に化合物の各鏡像異性体ならびに鏡像異性体のラセミ混合物を含む。「化合物」という用語は、明示的に述べられるかどうかにかかわらずこれらのありとあらゆる形態を含むものと理解される（「塩」については時には明示的に述べられるが）。

【0035】

当業者には理解されるように、ここで示されるあらゆる化合物について、そのあらゆる実施態様における以下のいずれかの1つの変数（例えばZ、X、Y、Y'、R<sub>A</sub>、R<sub>B</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>1-1</sub>、Q、R<sub>1-3</sub>、nなど）をそれらのあらゆる実施態様におけるあらゆる1つ以上のその他の変数と組み合わせ、ここで述べられるあらゆる式と関連づけることができる。得られる変数の各組み合わせは、本発明の実施態様である。

40

【0036】

特定の実施態様では、Aは-O-、-C(O)-、-S(O)<sub>0-2</sub>-、-CH<sub>2</sub>-、および-N(R<sub>4</sub>)-からなる群から選択される。

【0037】

特定の実施態様では、Qは-O-または-S-である。特定の実施態様では、Qは-O-である。

【0038】

特定の実施態様では、Q'は結合、-C(R<sub>6</sub>)-、-C(R<sub>6</sub>)-C(R<sub>6</sub>)-、-S

50

(O)<sub>2</sub>-、および -S(O)<sub>2</sub>-N(R<sub>8</sub>)- からなる群から選択される。

【0039】

特定の実施態様では、Vは -C(R<sub>6</sub>)-、-O-C(R<sub>6</sub>)-、および -S(O)<sub>2</sub>- からなる群から選択される。

【0040】

特定の実施態様では、Xは任意に1つ以上の -O- 基によって中断されるアルキレンである。特定の実施態様では、Xは C<sub>1-6</sub>アルキレンまたは -(CH<sub>2</sub>)<sub>2-4</sub>-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>1-3</sub>- である。特定の実施態様では、Xはアルキレンである。特定の実施態様では、Xは -(CH<sub>2</sub>)<sub>1-6</sub>-、-CH<sub>2</sub>-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-O-CH<sub>2</sub>-、および -CH<sub>2</sub>-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- からなる群から選択される。特定の実施態様では、Xは -CH<sub>2</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-、-(CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>-、-CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-、-CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、および -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>- からなる群から選択される。

10

【0041】

特定の実施態様では、X'はアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アリーレン、およびヘテロアリーレンからなる群から選択され、アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレン基は、アリーレンまたはヘテロアリーレンで任意に中断または終端されることができ、任意に1つ以上の -O- 基によって中断される。

【0042】

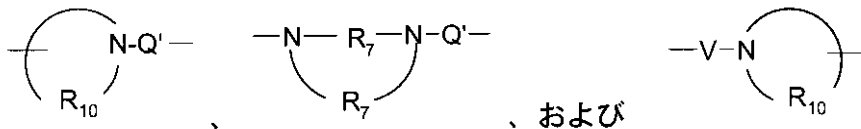
特定の実施態様では、Yは -O- または -S(O)<sub>0-2</sub>- である。

20

【0043】

特定の実施態様では、Y'は -S(O)<sub>0-2</sub>-、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sub>8</sub>)-、-C(R<sub>6</sub>)-、-C(R<sub>6</sub>)-O-、-O-C(R<sub>6</sub>)-、-O-C(O)-O-、-N(R<sub>8</sub>)-Q'-、-C(R<sub>6</sub>)-N(R<sub>8</sub>)-、-O-C(R<sub>6</sub>)-N(R<sub>8</sub>)-、-C(R<sub>6</sub>)-N(OR<sub>9</sub>)-、

【化26】



30

からなる群から選択される。

【0044】

特定の実施態様では、Zは -C(O)-、-C(O)O-、または -C(-Q-R<sub>1-3</sub>)<sub>2</sub>- である。特定の実施態様では、Zは -C(O)- である。特定の実施態様では、Zは -C(O)O- である。特定の実施態様では、Zは -C(-Q-R<sub>1-3</sub>)<sub>2</sub>- である。

【0045】

特定の実施態様では、Rはフルオロ、アルキル、アルコキシ、ハロアルキル、および -N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub> からなる群から選択される。これら内の特定の実施態様では、R<sub>9</sub>は水素およびアルキルからなる群から選択される。

40

【0046】

特定の実施態様では、R<sub>A</sub>およびR<sub>B</sub>はそれぞれ独立して、水素、ハロゲン、アルキル、アルケニル、アルコキシ、アルキルチオ、および -N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub> からなる群から選択される。特定の実施態様では、R<sub>A</sub>およびR<sub>B</sub>はそれぞれ独立して水素およびアルキルからなる群から選択される。特定の実施態様では、R<sub>A</sub>およびR<sub>B</sub>はどちらもメチルである。

【0047】

特定の代案の実施態様では、R<sub>A</sub>およびR<sub>B</sub>は非置換のまたは1つ以上のR基によって置換された縮合アリーール環を形成する。

50

## 【0048】

特定の代案の実施態様では、 $R_A$ および $R_B$ は非置換のまたは1つ以上の $R_g$ 基によって置換された縮合した5～7員環の飽和環を形成する。

## 【0049】

特定の実施態様では、 $R_g$ はハロゲン、ヒドロキシ、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、および $-N(R_g)_2$ からなる群から選択される。

## 【0050】

特定の実施態様では、 $R_{A'}$ および $R_{B'}$ はそれぞれ独立して、水素、ハロゲン、アルキル、アルケニル、アルコキシ、アルキルチオ、および $-N(R_g)_2$ からなる群から選択される。特定の実施態様では、 $R_{A'}$ および $R_{B'}$ は独立して水素およびアルキルからなる群から選択される。特定の実施態様では、 $R_{A'}$ および $R_{B'}$ はどちらもメチルである。

10

## 【0051】

特定の実施態様では、 $R_{1-1}$ は水素、アルキル、アリール、アルキレン-アリール、ヘテロアリール、アルキレン-ヘテロアリール、およびハロゲン、シアノ、ニトロ、アルコキシ、ジアルキルアミノ、アルキルチオ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキル、 $-NH-SO_2-R_{1-4}$ 、 $-NH-C(O)-R_{1-4}$ 、 $-NH-C(O)-NH_2$ 、 $-NH-C(O)-NH-R_{1-4}$ 、および $-N_3$ からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されたアルキル、アリール、アルキレン-アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン-ヘテロアリールからなる群から選択される。

## 【0052】

特定の実施態様では、 $R_{1-1}$ はアリール、アルキル、および $-N(CH_3)OCH_3$ からなる群から選択される。特定の実施態様では、 $R_{1-1}$ はアリール、アルキル、および水素からなる群から選択される。特定の実施態様では、 $R_{1-1}$ はアルキルおよびアリールからなる群から選択される。特定の実施態様では、 $R_{1-1}$ はメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、イソブチル、*tert*-ブチル、*n*-ペンチル、シクロペンチル、*n*-ヘキシル、シクロヘキシル、フェニル、4-クロロフェニル、および2,4-ジクロロフェニルからなる群から選択される。

20

## 【0053】

特定の実施態様では、 $R_{1-3}$ はアルキル、アリール、アルキレン-アリール、ヘテロアリール、アルキレン-ヘテロアリール、およびハロゲン、シアノ、ニトロ、アルコキシ、ジアルキルアミノ、アルキルチオ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキル、 $-NH-SO_2-R_{1-4}$ 、 $-NH-C(O)-R_{1-4}$ 、 $-NH-C(O)-NH_2$ 、 $-NH-C(O)-NH-R_{1-4}$ 、および $-N_3$ からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されたアルキル、アリール、アルキレン-アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン-ヘテロアリールからなる群から選択される。特定の実施態様では、 $R_{1-3}$ 基は、一緒になって環系を形成できる。環系としては5-、6-、または7-員環が挙げられる。当業者はそれらが化合物の免疫調節活を損なわなければ(すなわち非妨害性であれば)、環系のサイズと構成要素が制限されないことを理解するであろう。典型的に、これは5-、6-、または7-員環が非置換であり、または1または2個の飽和または不飽和5-、6-、または7-員環に任意に縮合し、またはアリール、ヘテロアリール、ハロゲン、ハロアルキル、アルキレン-O-アルキル、および置換アリールからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されることを意味する。特定の実施態様では $R_{1-3}$ はアルキルであり、または $R_{1-3}$ 基は結合して5-員環を形成する。

30

40

## 【0054】

特定の実施態様では、 $R_{1-4}$ はアルキル、アリール、アルキレン-アリール、ヘテロアリール、アルキレン-ヘテロアリール、およびハロゲン、シアノ、ニトロ、アルコキシ、ジアルキルアミノ、アルキルチオ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、アルキル、および $-N_3$ からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン-アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン-ヘテロアリールからなる群から選択される。

50

## 【 0 0 5 5 】

特定の実施態様では、 $R_{1-6}$ はアルキルであり、または $R_{1-6}$ 基は一緒になって飽和5 - または6 - 員環を含んでなる環系を形成できる。

## 【 0 0 5 6 】

特定の実施態様では、 $R_2$ は水素、アルキル、アルケニル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、アルキレン - Y - アルキル、アルキレン - Y - アルケニル、アルキレン - Y - アリール、およびヒドロキシ、ハロゲン、 $-N(R_3)_2$ 、 $-C(O)-C_{1-10}$ アルキル、 $-C(O)-O-C_{1-10}$ アルキル、 $-N(R_3)-C(O)-C_{1-10}$ アルキル、 $-N_3$ 、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $-C(O)-$ アリール、および $-C(O)-$ ヘテロアリールからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されたアルキルまたはアルケニルからなる群から選択される。これらの内の特定の実施態様では、Yは $-O-$ または $-S(O)_{0-2}-$ であり、 $R_3$ は水素、 $C_{1-10}$ アルキル、および $C_{2-10}$ アルケニルからなる群から選択される。

10

## 【 0 0 5 7 】

特定の実施態様では、 $R_2$ は水素、アルキル、ヒドロキシアルキル、およびアルコキシアルキルからなる群から選択される。特定の実施態様では、 $R_2$ は水素、アルキル、およびアルコキシアルキルからなる群から選択される。特定の実施態様では、 $R_2$ は水素、ヒドロキシメチル、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、 $n$ -ブチル、エトキシメチル、および2 - メトキシエチルからなる群から選択される。

## 【 0 0 5 8 】

特定の実施態様、特に式 I - 1 の実施態様では、 $R_2$ は $-R_4$ 、 $-X'-R_4$ 、 $-X'-Y'-R_4$ 、および $-X'-R_5$ からなる群から選択される。

20

## 【 0 0 5 9 】

特定の実施態様では、 $R_3$ は水素、 $C_{1-10}$ アルキル、および $C_{2-10}$ アルケニルからなる群から選択される。

## 【 0 0 6 0 】

特定の実施態様では、 $R_4$ は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニル、からなる群から選択され、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニル基は、非置換でもまたは独立して、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、アリール、アリールオキシ、アリールアルキレンオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキレンオキシ、ヘテロシクリル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、(ジアルキルアミノ)アルキレンオキシ、および[アルキル、アルケニル、およびアルキニルの場合は]オキソからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されていることもできる。

30

## 【 0 0 6 1 】

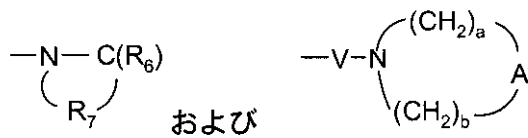
特定の実施態様では $R_4$ はアルキルであり、それは非置換でもまたはヒドロキシまたはアルコキシによって置換されていてもよい。

40

## 【 0 0 6 2 】

特定の実施態様では、 $R_5$ は

## 【化 27】



からなる群から選択される。

## 【0063】

特定の実施態様では、 $R_6$ は=Oおよび=Sからなる群から選択される。

## 【0064】

特定の実施態様では、 $R_7$ は $C_{2-7}$ アルキレンである。

## 【0065】

特定の実施態様では、 $R_8$ は水素、アルキル、アルコキシアルキレニル、およびアリー  
ルアルキレニルからなる群から選択される。特定の実施態様では、 $R_8$ はHまたは $CH_3$ で  
ある。

## 【0066】

特定の実施態様では、 $R_9$ は水素およびアルキルからなる群から選択される。

## 【0067】

特定の実施態様では、 $R_{10}$ は $C_{3-8}$ アルキレンである。

## 【0068】

特定の実施態様では、 $a$ および $b$ は独立して1~6の整数であるが、ただし $a+b$ は  
7である。

## 【0069】

特定の実施態様では、 $n$ は0~4の整数である。特定の実施態様では、 $n$ は0である。

## 【0070】

特定の実施態様、特に式(I-1)の実施態様では、 $Z$ が $-C(O)-$ であれば $R_{1-1}$   
は $-N(CH_3)(OCH_3)$ であってもよく、 $Z$ が $-C(O)O-$ であれば $R_{1-1}$ は水素  
でなく、 $Z$ が $-C(O)O-$ であれば $X$ は $-O-$ 基を含まない。

## 【0071】

特定の実施態様、特に式(I-2)の実施態様では、 $Z$ が $-C(O)-$ であれば $R_{1-1}$   
は $-N(CH_3)(OCH_3)$ であってもよく、 $Z$ が $-C(O)O-$ であれば $R_{1-1}$ は水素  
でなく、 $Z$ が $-C(O)O-$ であれば $X$ は $-O-$ 基を含まない。

## 【0072】

特定の実施態様、特に式(I-3)の実施態様では、 $Z$ が $-C(O)-$ であれば $R_{1-1}$   
は $-N(CH_3)(OCH_3)$ であってもよく、 $Z$ が $-C(O)O-$ であれば $R_{1-1}$ は水素  
でなく、 $Z$ が $-C(O)O-$ であれば $X$ は $-O-$ 基を含まない。

## 【0073】

特定の実施態様、特に式(I-4)の実施態様では、 $Z$ が $-C(O)-$ であれば $R_{1-1}$   
は $-N(CH_3)(OCH_3)$ であってもよく、 $Z$ が $-C(O)O-$ であれば $R_{1-1}$ は水素  
でなく、 $Z$ が $-C(O)O-$ であれば $X$ は $-O-$ 基を含まない。

## 【0074】

特定の実施態様、特に式(II)の実施態様では、 $Z$ が $-C(O)-$ であれば $R_{1-1}$ は  
 $-N(CH_3)(OCH_3)$ であってもよく、 $Z$ が $-C(O)O-$ であれば $R_{1-1}$ は水素で  
なく、 $Z$ が $-C(O)O-$ であれば $X$ は $-O-$ 基を含まない。

## 【0075】

特定の実施態様では、 $Z$ は $-C(O)-$ であり、好ましくは $R_{1-1}$ はアリール、アルキ  
ル、および $-N(CH_3)OCH_3$ からなる群から選択される。特定のその他の実施態様で  
は、 $R_{1-1}$ はメチル、エチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル、シクロプロピル、 $n$ -ブチ

10

20

30

40

50

ル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、n-ペンチル、シクロペンチル、n-ヘキシル、シクロヘキシル、フェニル、4-クロロフェニル、および2,4-ジクロロフェニルからなる群から選択される。

【0076】

特定の実施態様では、Zは-C(O)O-であり、好ましくは $R_{1-1}$ はアルキルおよびアリールからなる群から選択される。

【0077】

特定の実施態様では、Zは-C(-Q-R<sub>1-3</sub>)<sub>2</sub>-であり、好ましくは $R_{1-1}$ はアルキル、アリール、および水素からなる群から選択される。これらの内の特定の実施態様では、Qは-O-である。

10

【0078】

特定の実施態様では、Zは-C(-Q-R<sub>1-3</sub>)<sub>2</sub>-であり、好ましくは $R_{1-3}$ 基の結合によって形成された5-、6-、または7-員環は、1または2個の飽和または不飽和5-、6-、または7-員環に任意に縮合し、またはアリール、ヘテロアリール、ハロゲン、ハロアルキル、アルキレン-O-アルキル、および置換アリールからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換される。これらの内の特定の実施態様では、 $R_{1-3}$ はアルキルであり、または $R_{1-3}$ 基は結合して5-員環を形成する。

【0079】

化合物の調製

本発明の化合物は、ここで示す経路に従って調製でき、 $R_{1-1}$ が-N(CH<sub>3</sub>)(OCH<sub>3</sub>)以外であることを除いては、 $R_{1-1}$ 、 $R_{1-3}$ 、 $R_{1-6}$ 、 $R_2$ 、R、Q、X、およびnは上で定義されるようである。反応スキーム1a、1b、2b、4、および6では、Rはヒドロキシでなく、 $R_{1-1}$ は水素でなく、 $R_{1-1}$ および $R_2$ は当業者がグリニヤール試薬と反応性であると認識する置換基を含有しない。これらの置換基としては、例えばケトン、エステル、ヒドロキシ、およびシアノ(すなわち、ニトリル)基、ならびに-NH-を含有する基が挙げられる。

20

【0080】

式Iaの本発明のケトンは、反応スキーム1aおよび1bで示されるように、ケトン基がアルコール中間体から誘導される2つの経路の1つによって調製できる。代案としては本発明のケトンは、反応スキーム2aおよび2bで示されるように、ケトン基がケタールまたはアセタール中間体反応から誘導される経路によって調製できる。別の代案の実施態様では、それらは、反応スキーム4で示されるようにケトン基がエステル中間体から誘導される経路によって調製できる。

30

【0081】

式XXIの本発明のケタールまたはアセタールは、式IIIの化合物の調製の概要についても述べる反応スキーム2aで示される経路によって調製できる。式Idの本発明のケタールまたはアセタールは、反応スキーム3で示される経路によって調製できる。

【0082】

式Ibの本発明のエステルは、その調製が反応スキーム4で示される式XXVの化合物から開始して、反応スキーム5で示されるように調製できる。

40

【0083】

式Ieの本発明のワインレブアミドは、反応スキーム4で示されるように、アミド基がエステル中間体から誘導される経路によって調製できる。

【0084】

反応スキーム1a

反応スキーム1aのステップ(1)では、ジクロロメタンなどの適切な溶剤中において、トリエチルアミン存在下で式VIの4-クロロ-3-ニトロキノリンがアミノアルコールによって処理され、アミノアルコールは一般式H<sub>2</sub>N-X-CH<sub>2</sub>-OHを有し、Xはここで定義される通りである。式H<sub>2</sub>N-X-CH<sub>2</sub>-OHの多数のアミノアルコールが市販され、その他はよく知られている方法を使用して容易に合成できる。多くの式VIの4-

50

クロロ - 3 - ニトロキノリンが知られており、または既知の合成方法を使用して調製できる。例えばここで参照する米国特許第 4, 689, 338 号明細書、米国特許第 5, 175, 296 号明細書、米国特許第 5, 367, 076 号明細書、および米国特許第 5, 389, 640 号明細書を参照されたい。

【0085】

得られる式 V I I の化合物は、多様な方法を使用して反応スキーム 1 a のステップ ( 2 ) で還元され、式 V I I I のキノリン - 3, 4 - ジアミンが得られる。反応は炭素上の白金などの不均一水素付加触媒を使用して、水素付加によって実施できる。水素付加は、トルエンまたはエタノールなどの適切な溶剤中において、パール装置内で都合良く実施される。反応は周囲温度で実施でき、生成物は従来の方法を使用して単離できる。

10

【0086】

代案としては、1 - または 2 - 相ナトリウム亜ジチオン酸塩還元を使用してステップ ( 2 ) を実施できる。反応は、パーク ( Park ), K . K . ; オー ( Oh ), C . H . ; およびジョン ( J o u n g ), W . K . ; Tetrahedron Lett . 1993 年、34、7445 ~ 7446 頁で述べられる条件を使用して、炭酸カリウムおよびエチルピオロゲンジプロミドの存在下で、周囲温度において、ジクロロメタンおよび水の混合物中で、式 V I I の化合物にナトリウム亜ジチオン酸塩を添加して都合良く実施される。生成物は従来の方法を使用して単離できる。

【0087】

反応スキーム I a のステップ ( 3 ) では、式 V I I I のキノリン - 3, 4 - ジアミンがカルボン酸同等物で処理され、式 I X の 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリンが得られる。適切なカルボン酸同等物としては、式  $R_2C(O-アルキル)_3$  のオルトエステル、式  $R_2C(O-アルキル)_2(O-C(O)-アルキル)$  の 1, 1 - ジアルコキシアルキルアルカノエート、および式  $R_2C(O)Cl$  の酸塩化物が挙げられる。カルボン酸同等物の選択は、 $R_2$  における所望の置換基によって定まる。例えばオルトギ酸トリエチルは  $R_2$  が水素である化合物を提供し、オルト吉草酸トリメチルは、 $R_2$  がブチル基である化合物を提供する。反応は、トルエンまたはキシレンなどの適切な溶剤中で、カルボン酸同等物を式 V I I I のキノリン - 3, 4 - ジアミンに添加して都合良く実施される。任意に、触媒のピリジン塩酸塩またはピリジウム p - トルエンスルホネートが添加できる。反応中に形成するアルコールまたは水を追い出すのに十分高い温度で反応を実施する。ディーンスタークトラップを使用して、都合良く揮発性物質を収集できる。

20

30

【0088】

任意に、ステップ ( 2 ) に先だって、適切なアルコール保護基により、式 V I I の化合物上のアルコール基を保護でき、この保護基はステップ ( 4 ) に先だって除去できる。適切な保護基としては、従来の方法を使用して導入および除去できる tert - ブチルジメチルシリル基が挙げられる。

【0089】

反応スキーム 1 a のステップ ( 4 ) では、例えばスワン条件などの従来の方法を使用して、式 I X のアルコール - 置換された 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリンが、式 X のアルデヒド - 置換された 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリンに酸化される。スワン酸化は、ジクロロメタンなどの適切な溶剤中において、式 I X の化合物、続いてトリエチルアミンを塩化オキサリルおよびジメチルスルホキシドの混合物に添加して、都合良く実施される。反応は - 78 などの周囲以下の温度で実施でき、生成物は従来の方法を使用して単離できる。

40

【0090】

次に反応スキーム 1 a のステップ ( 5 ) で、式 X のアルデヒド - 置換された 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリンがグリニヤール試薬で処理される。グリニヤール試薬は式  $R_{1-1}Mg$  のハロゲン化物であり、式 X I の化合物を形成する。これらの試薬のいくつかは市販され、その他は既知の合成方法を使用して調製できる。反応は、テトラヒドロフランなどの適切な溶剤中において、グリニヤール試薬の溶液を式 X の化合物の溶液に添加して

50

都合良く実施される。反応は周囲温度で実施でき、生成物は従来の方法を使用して単離できる。

【0091】

反応スキーム1aのステップ(6)では、従来の方法を使用して、式XIのアルコール-置換された1H-イミダゾ[4,5-c]キノリンが式XIIのケトンに酸化される。反応は上のステップ(4)で述べられるスワン条件下で都合良く実施される。

【0092】

反応スキーム1aのステップ(7)では、このような化合物を形成できる従来酸化剤を使用して、式XIIのケトン-置換された1H-イミダゾ[4,5-c]キノリンが酸化されて、式XIIIのN-オキシドが得られる。例えば周囲温度において、クロロホルムまたはジクロロメタンなどの溶剤中で、式XIIの化合物の溶液に3-クロロペルオキシ安息香酸を添加して、反応を都合良く実施できる。

10

【0093】

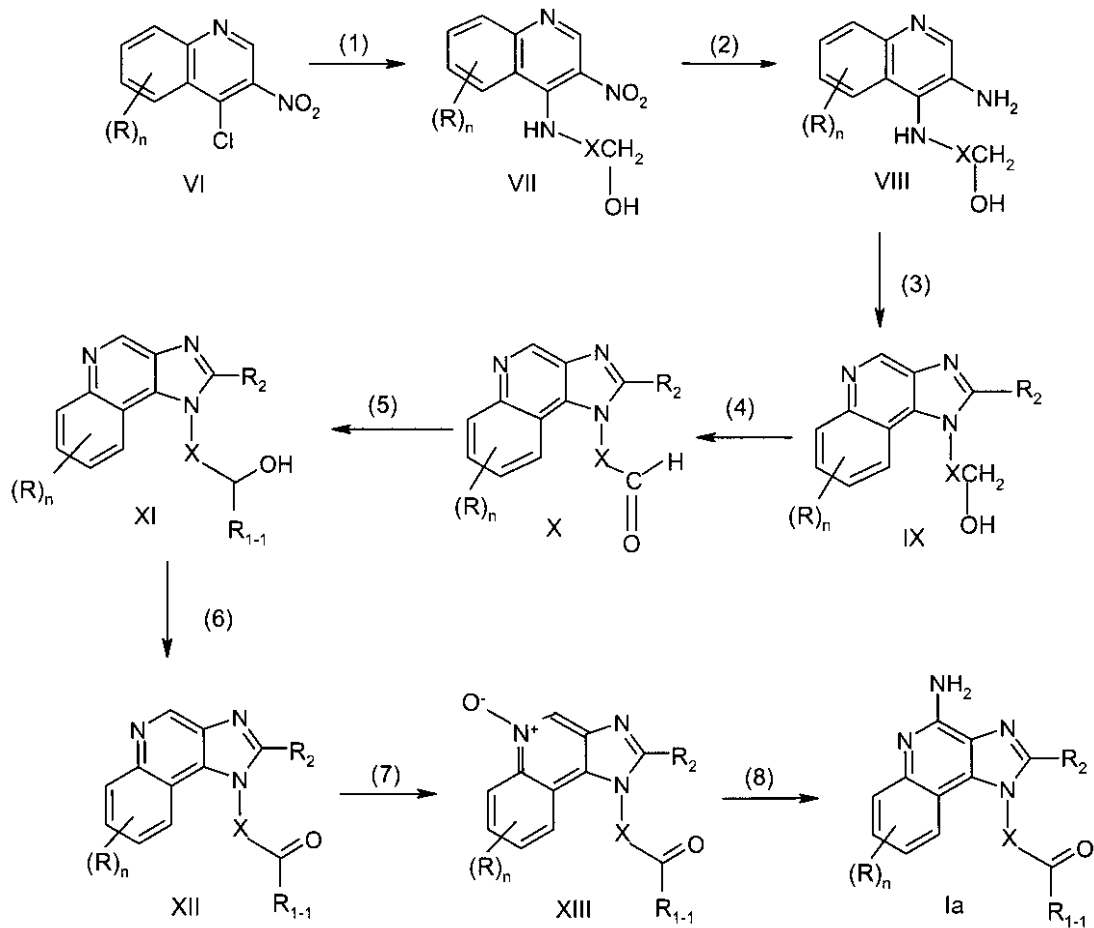
反応スキーム1aのステップ(8)では、式XIIIのN-オキシドがアミノ化されて、式Iaのケトン-置換された1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミンが得られる。ステップ(8)は、エステルへの転換による式XIIIのN-オキシドの活性化、次にエステルとアミノ化剤とを反応させることを伴う。適切な活性化剤としては、塩化ベンゼンスルホニル、塩化メタンスルホニル、または塩化p-トルエンスルホニルなどの塩化アルキル-または塩化アリールスルホニルが挙げられる。適切なアミノ化剤としては、例えば水酸化アンモニウムの形態のアンモニア、および炭酸アンモニウム、炭酸水素アンモニウム、およびリン酸アンモニウムなどのアンモニウム塩が挙げられる。反応は、ジクロロメタンまたはクロロホルムなどの適切な溶剤中において、水酸化アンモニウムを式XIIIのN-オキシドの溶液に添加して、次に塩化p-トルエンスルホニルを添加して都合良く実施される。反応は周囲温度で実施できる。得られる式Iaのケトン-置換された1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミンまたはその薬学上許容可能な塩は、従来の方法を使用して反応混合物から単離できる。

20

【0094】

反応スキーム1a

## 【化 2 8】



10

20

30

40

50

## 【0095】

## 反応スキーム 1 b

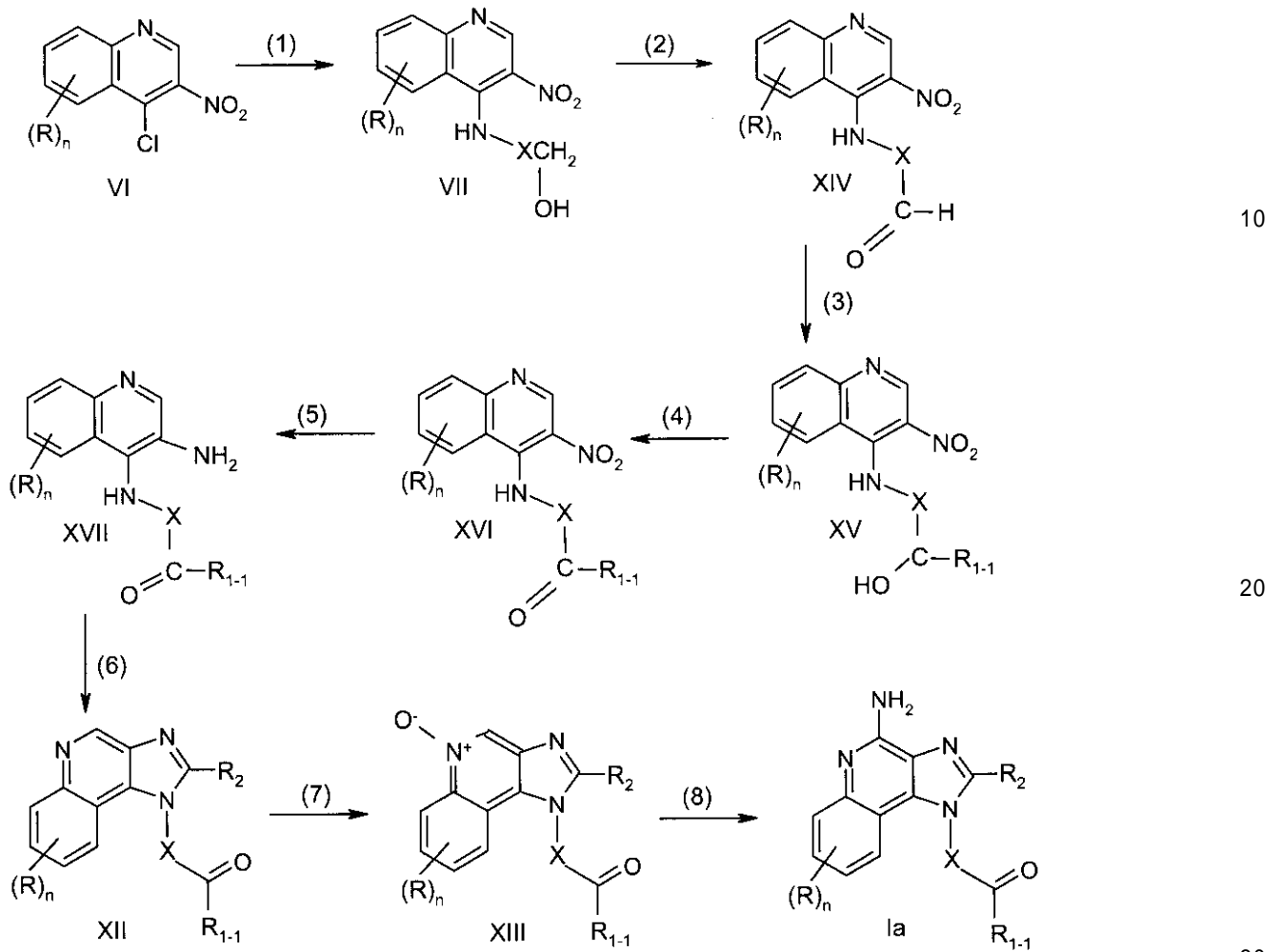
反応スキーム 1 b では、反応は反応スキーム 1 a のものと非常に類似しているが異なる順序である。反応スキーム 1 b のステップ (1) では、反応スキーム 1 a のステップ (1) と同様に、式 VI の 4 - クロロ - 3 - ニトロキノリンがアミノアルコールで処理される。ステップ (2) では、反応スキーム 1 a のステップ (4) と同様に、得られる式 VII の化合物が従来の方法を使用して酸化され、式 IX のアルデヒドが形成される。ステップ (3) では、反応スキーム 1 a のステップ (5) と同様に、得られる式 IX のアルデヒドがグリニヤール試薬で処理され式 XI の化合物が形成される。

ステップ (4) では、反応スキーム 1 a のステップ (6) と同様に、式 XI の化合物が酸化されて式 XIII の化合物が形成される。ステップ (5) では、反応スキーム 1 a のステップ (2) と同様に、式 XIII の化合物が還元されて、式 VIII のケトン - 置換されたキノリン - 3, 4 - ジアミンが形成される。ステップ (6) では、反応スキーム 1 a のステップ (3) と同様に、例えばオルトエステルを使用して式 VIII のキノリン - 3, 4 - ジアミンが環化され、式 XII のケトン - 置換された 1H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリンが形成される。ステップ (7) では、反応スキーム 1 a のステップ (7) と同様に、式 XII の化合物が N - オキシドに酸化されて式 XIII の化合物が形成される。ステップ (8) では、反応スキーム 1 a のステップ (8) と同様に、式 XIII の N - オキシドがアミノ化されて、式 Ia のケトン - 置換された 1H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリン - 4 - アミンが得られる。

## 【0096】

## 反応スキーム 1 b

## 【化 2 9】



## 【0097】

## 反応スキーム 2 a

式 Ia の本発明のケトン、および式 XXI の本発明のケタールおよびアセタールは反応スキーム 2 a に従って調製できる。反応スキーム 2 a のステップ (1) では、クロロホルムまたはジクロロメタンなどの適切な溶剤中において、トリエチルアミンの存在下で、式 VI の 4-クロロ-3-ニトロキノリンが、アミノケタールなどの式 H<sub>2</sub>N-X-C(R<sub>1-1</sub>)(O-R<sub>1-6</sub>)<sub>2</sub> (式中、R<sub>1-1</sub> はメチルであり、R<sub>1-6</sub> はエチレンである) の化合物と反応する。式 H<sub>2</sub>N-X-C(R<sub>1-1</sub>)(O-R<sub>1-6</sub>)<sub>2</sub> の化合物は市販され、または従来の方法を使用して容易に合成できる。例えば C. J. スチュワート (Stewart) ら、J. Liebigs Ann. der Chem., 1978 年、57~65 頁および PCT 公報国際公開第 01/51486 号パンフレットを参照されたい。

## 【0098】

式 H<sub>2</sub>NCH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>C(O-R<sub>1-6</sub>)<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> のケタールは、ニトロメタンとメシチルオキシドとの反応、得られるケトンのケタールへの転換、およびニトロ基のアミンへの還元によって、参照した方法に従って調製できる。

## 【0099】

得られる式 VII の化合物は、反応スキーム 2 a のステップ (2) で多様な方法を使用して還元され、式 III のケタール-またはアセタール-置換されたキノリン-3,

4 - ジアミンが形成できる。還元は反応スキーム 1 a のステップ ( 2 ) で述べられるようにして実施できる。

【 0 1 0 0 】

反応スキーム 2 a のステップ ( 3 ) では、式 I I I のキノリン - 3 , 4 - ジアミンがカルボン酸同等物で処理され、式 X I X のケタール - またはアセタール - 置換された 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリンが形成される。反応は、反応スキーム 1 a のステップ ( 3 ) で述べられるようにして実施できる。

【 0 1 0 1 】

反応スキーム 2 a のステップ ( 4 ) では、反応スキーム 1 a のステップ ( 7 ) で概要が述べられる方法を使用して、式 X I X の 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリンが式 X X の N - オキシドに転換できる。ステップ ( 5 ) では、反応スキーム 1 a のステップ ( 8 ) で述べられるようにして、式 X X の N - オキシドが式 X X I の化合物 ( 式 I d の化合物のサブセット ) ( 例えばケタール ) にアミノ化できる。生成物またはその薬学上許容可能な塩は、従来の方法を使用して単離できる。

10

【 0 1 0 2 】

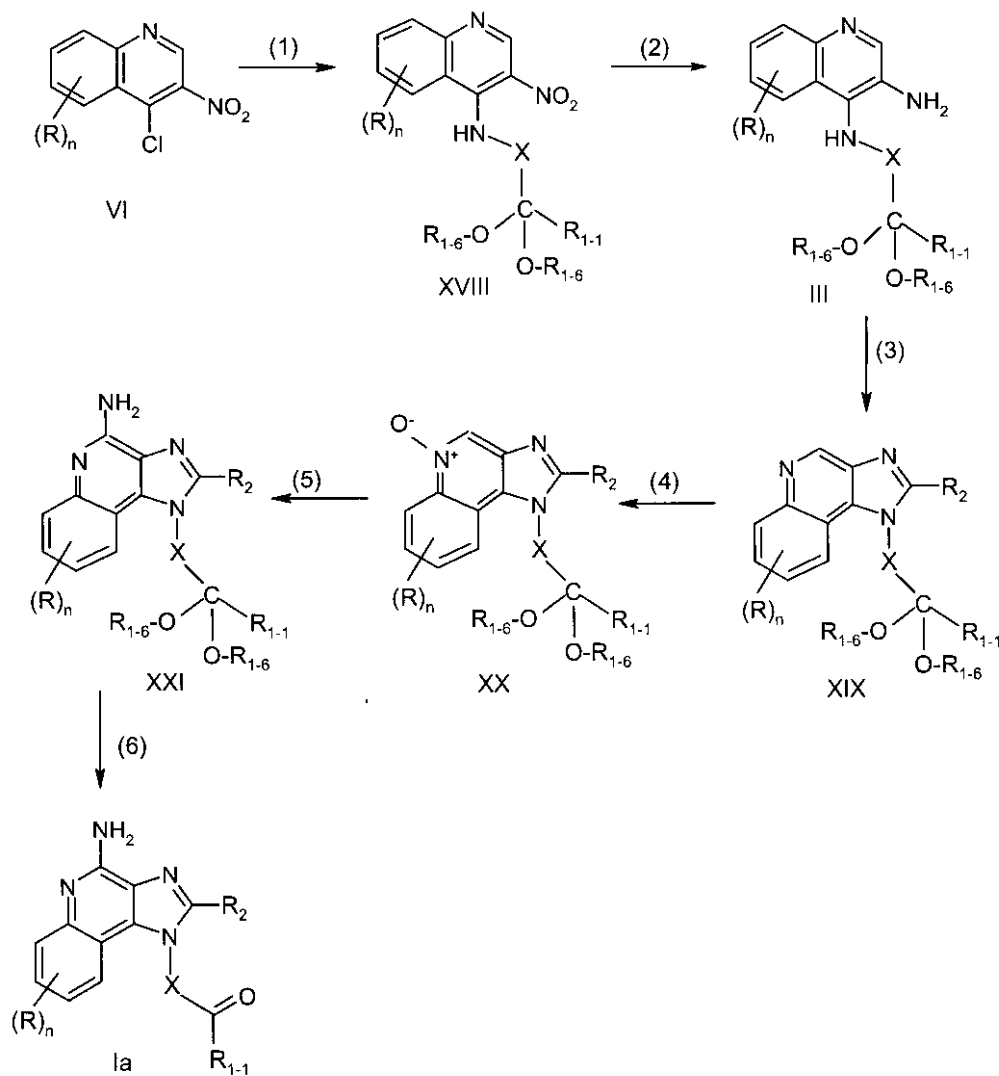
ステップ ( 6 ) では、酸触媒加水分解によって、式 X X I の化合物が式 I a のケトンに転換できる。反応は塩酸などの強酸を式 X X I のケタールに添加して、都合良く実施される。反応は水などの適切な溶剤中で、周囲温度で実施されてもよい。生成物またはその薬学上許容可能な塩は、従来の方法を使用して単離できる。

【 0 1 0 3 】

反応スキーム 2 a

20

## 【化 3 0】



10

20

30

## 【0104】

## 反応スキーム 2 b

式 I a の化合物はまた、反応スキーム 2 b に従って調製できる。反応スキーム 2 b のステップ (1) では、 $R_{1-1}$  が水素である式 X I X のサブセットである式 X I X - b のアセタールが酸触媒加水分解を被って、式 X のアルデヒドが得られる。反応は、反応スキーム 2 a のステップ (6) について述べられるようにして実施できる。

## 【0105】

反応スキーム 2 b のステップ (2) では、式 X のアルデヒドが式  $R_{1-1}$  Mg ハロゲン化合物のグリニヤール試薬と反応する。反応は、反応スキーム 1 a のステップ (5) で述べられるようにして実施され、式 X I のアルコールが得られる。

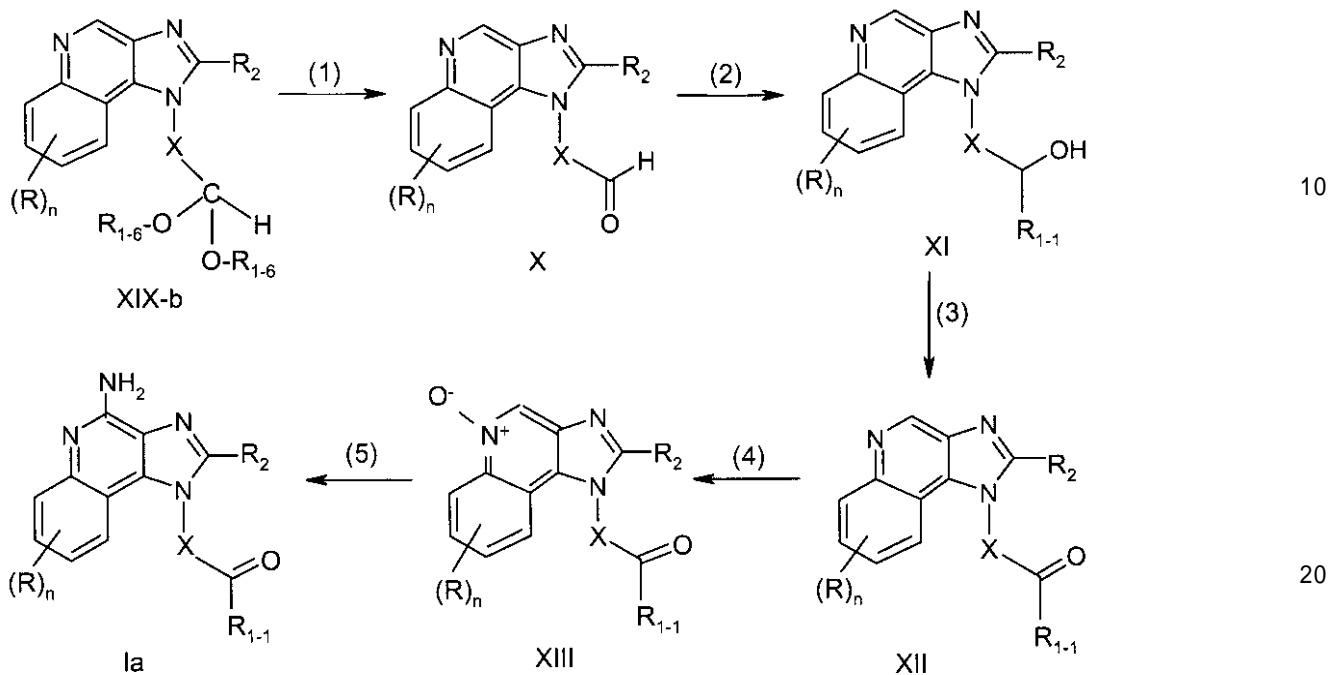
40

## 【0106】

反応スキーム 2 b のステップ (3) ~ (5) では、従来の方法を使用して、式 X I のアルコールが式 X I I のケトン - 置換された 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリンに酸化され、それは式 X I I I の N - オキシドに転換される。次に式 X I I I の化合物はアミノ化されて、式 I a のケトン - 置換された 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミンが得られる。反応スキーム 2 b のステップ (3)、(4)、および (5) は、反応スキーム 1 a のステップ (6)、(7)、および (8) について述べられるようにして実施できる。

50

【0107】  
 反応スキーム 2 b  
 【化 3 1】



【0108】  
 反応スキーム 3

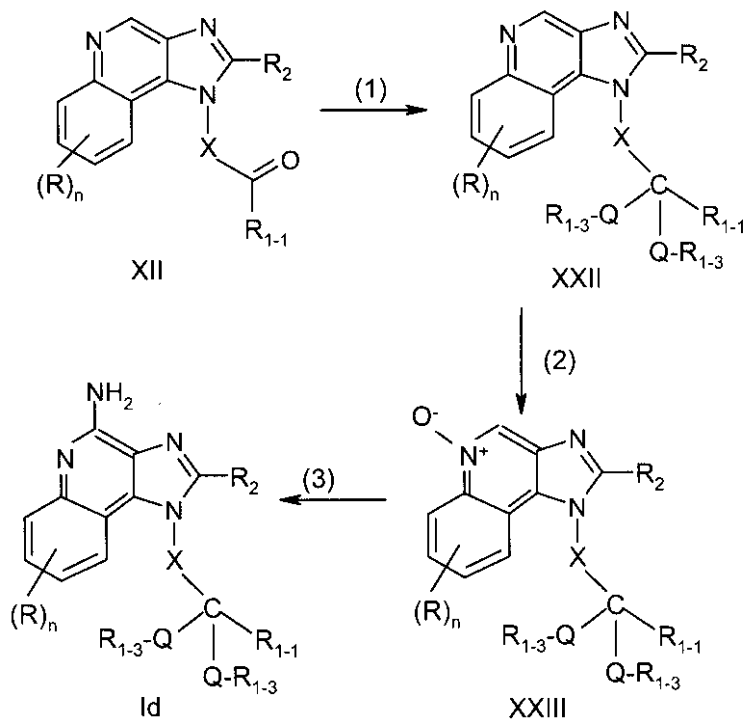
本発明のケタールおよびアセタールは、反応スキーム 3 に従って調製できる。反応スキーム 3 のステップ (1) は、式  $\text{H} - \text{Q} - \text{R}_{1-3}$  または  $\text{H} - \text{Q} - \text{R}_{1-3} - \text{Q} - \text{H}$  の化合物との反応による、式 XII のケトンまたはアルデヒドから式 XIX のケタールまたはアセタールへの転換を伴う。反応は、酸触媒の存在下で、式 XII のケトンまたはアルデヒドを式  $\text{H} - \text{Q} - \text{R}_{1-3} - \text{Q} - \text{H}$  の化合物または式  $\text{H} - \text{Q} - \text{R}_{1-3}$  の化合物の同等物 2 個で処理して実施できる。この反応の条件は、当業者によく知られている。例えばグリーン (Greene), T. W., ワッツ (Wuts), P. G. M. 「有機合成における保護基 (Protective Groups in Organic Synthesis)」, John Wiley & Sons, Inc.: New York, 第二版, 1991 年, p. 178. を参照されたい。

【0109】  
 反応スキーム 3 のステップ (2) では、式 XXII の化合物が式 XXIII の 1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-5N-オキシドに酸化され、次にそれは式 Id の 1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミンにアミノ化される。反応スキーム 3 のステップ (2) および (3) は、反応スキーム 1 a のステップ (7) および (8) と同様にして実施できる。生成物またはその薬学上許容可能な塩は、従来の方法を使用して単離できる。

【0110】  
 代案としては、式 Ia のケトンには、反応スキーム 3 のステップ (1) で述べられる反応によって、式 Id のケタールに転換できる。

【0111】  
 反応スキーム 3

## 【化 3 2】



10

20

## 【 0 1 1 2】

## 反応スキーム 4

式 I a および式 I e の化合物は、反応スキーム 4 に従って調製できる。反応スキーム 4 のステップ (1) では、式 V I の 4 - クロロ - 3 - ニトロキノリンが式  $\text{H}_2\text{N} - \text{X} - \text{C}(\text{O})(\text{O} - \text{R}_{1-1}) - \text{HCl}$  の化合物と反応して、式 X X I V の化合物が形成される。この反応は、ジクロロメタンなどの適切な溶剤中においてトリエチルアミン存在下で都合良く実施される。式  $\text{H}_2\text{N} - \text{X} - \text{C}(\text{O})(\text{O} - \text{R}_{1-1}) - \text{HCl}$  の化合物は市販され、または従来の方法を使用して容易に合成できる。例えば  $\text{R}_{1-1}$  がエチルであり X がプロピレンまたはドデシレンであるアミノエステルは、C. テンプル (Temple) ら、J. Med. Chem., 1988 年、31、697 ~ 700 頁の手順に従って合成できる。

30

## 【 0 1 1 3】

反応スキーム 4 のステップ (2) および (3) では、式 X X I V の化合物が還元されて式 I V のキノリン - 3, 4 - ジアミンが形成され、それをカルボン酸同等物によって環化して、式 X X V の 1H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリンが形成できる。反応スキーム 4 のステップ (2) および (3) は、反応スキーム 1 a のステップ (2) および (3) で述べられるようにして実施できる。

## 【 0 1 1 4】

ステップ (4) では、式 X X V の 1H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリンのエステル基がワインレブアミドに転換されて、式 X X V I の 1H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリンが得られる。形質転換は、カルボン酸が形成されるエステルの塩基促進性加水分解、従来の方法を使用した酸塩化物への転換によって実施され、最終的に酸塩化物を N, O - ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩で処理して、式 X X V I のワインレブアミドが形成できる。塩基促進性加水分解は、エタノールなどの適切な溶剤中で、水酸化ナトリウムを式 X X V のエステル - 置換された 1H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリンに添加して都合良く実施される。反応は周囲温度で実施でき、生成物は従来の方法を使用して単離できる。得られるカルボン酸の酸塩化物への転換は、ジクロロメタンなどの適切な溶剤中で、塩化オキサリルをカルボン酸溶液に緩慢に添加して都合良く実施される。反応は、0 などの周囲

40

50

以下の温度で実施できる。次に得られる酸塩化物をジクロロメタンなどの適切な溶剤中で、N, O - ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩、続いてトリエチルアミンによって処理できる。反応は周囲温度で実施でき、式 X X V I の生成物は従来の方法を使用して単離できる。

【 0 1 1 5 】

代案としては、式 X X V のエステル - 置換された 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリンをトリメチルアルミニウムおよび N , O - ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩からできたアルミニウム試薬で処理して、ステップ ( 4 ) を一段階で実施できる。反応は、ジクロロメタンなどの適切な溶剤中の式 X X V のエステル - 置換された 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリンの溶液を、ジクロロメタンなどの適切な溶剤中のトリメチルアルミニウムおよび N , O - ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩の予備反応させた混合物に添加して、都合良く実施される。次に反応を例えば溶剤の還流温度などの高温に加熱できる。生成物は従来の方法を使用して単離できる。

10

【 0 1 1 6 】

反応スキーム 4 のステップ ( 5 ) および ( 6 ) では、式 X X V I の 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリンが式 X X V I I の N - オキシドに転換され、それはアミノ化されて式 I e の 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミンが得られる。反応スキーム 4 のステップ ( 5 ) および ( 6 ) は、反応スキーム 1 a のステップ ( 7 ) および ( 8 ) で述べられるようにして実施できる。生成物またはその薬学上許容可能な塩は従来の方法を使用して単離できる。

20

【 0 1 1 7 】

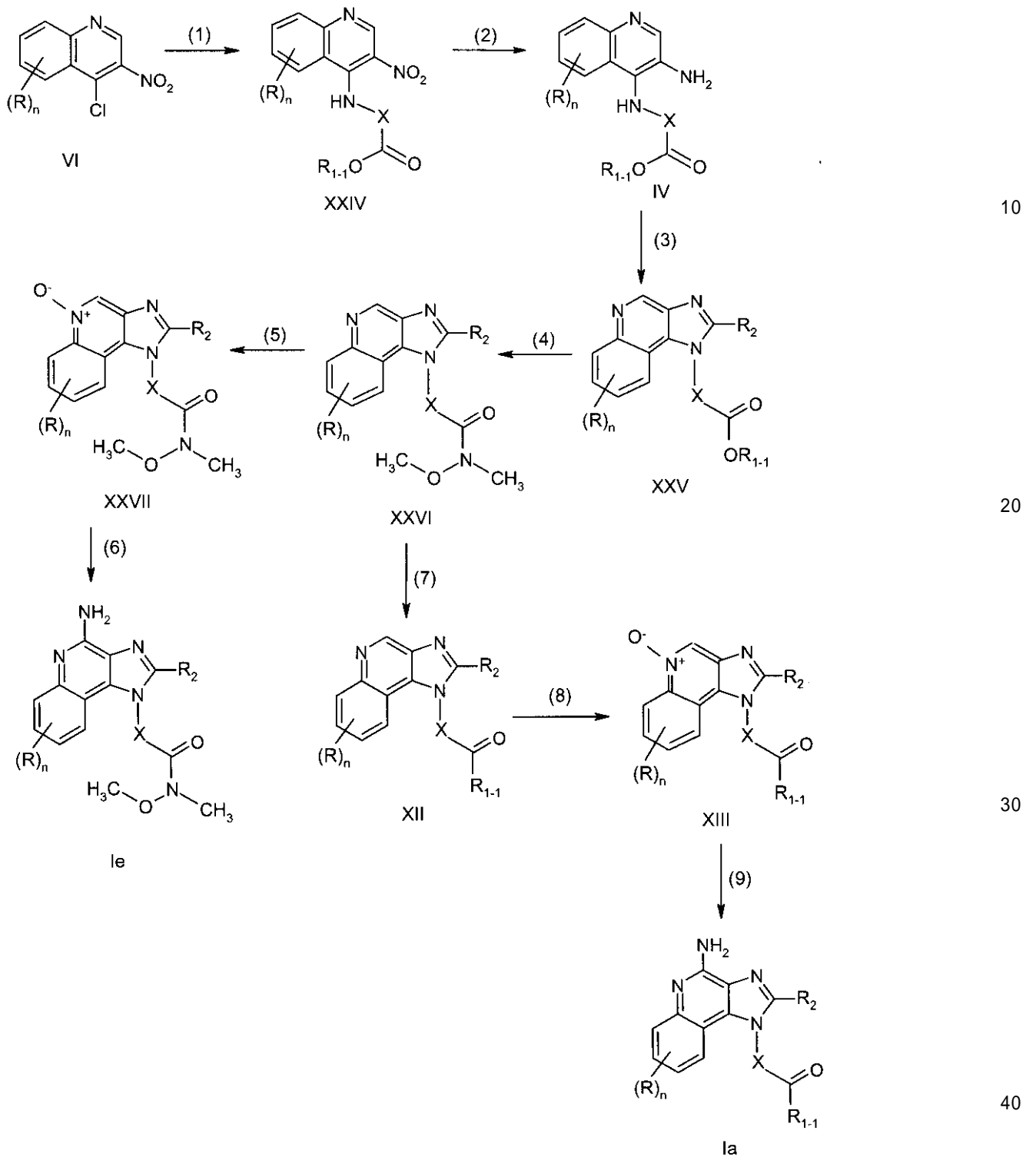
式 I a の化合物は、反応スキーム 4 のステップ ( 7 ) 、 ( 8 ) 、および ( 9 ) で示される代案の経路を使用して入手できる。式 X X V I のワインレブアミドは、ステップ ( 7 ) において式  $R_{1-1}Mg$  ハロゲン化物のグリニヤール試薬で処理されて式 X I I のケトンが形成される。グリニヤール反応は、反応スキーム 1 a のステップ ( 5 ) で述べられるようにして実施できる。ステップ ( 8 ) では、反応スキーム 1 a のステップ ( 7 ) で述べられるようにして、式 X I I のケトン - 置換された 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリンが式 X I I I の N - オキシドに酸化される。ステップ ( 9 ) では、反応スキーム 1 a のステップ ( 8 ) で述べられるようにして式 X I I I の N - オキシドがアミノ化され、式 I a のケトン - 置換された 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミンが得られる。

30

【 0 1 1 8 】

反応スキーム 4

## 【化 3 3】



10

20

30

40

50

## 【 0 1 1 9 】

## 反応スキーム 5

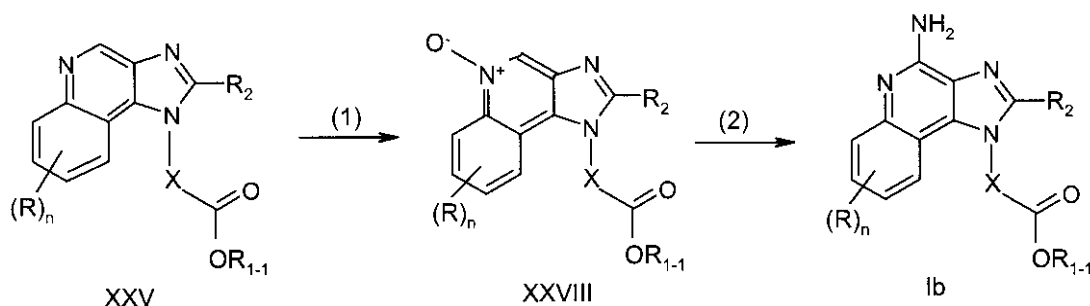
反応スキーム 5 では、反応スキーム 5 のステップ (1) ~ (3) で述べられるようにして調製された式 XXV の 1H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリンが、式 I b の化合物に転換される。ステップ (1) では、反応スキーム 1 a のステップ (7) と同様に、式 XXV の 1H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリンが N - オキシドに酸化されて式 XXVII の

化合物が形成される。ステップ(2)では、反応スキーム1aのステップ(8)と同様に、式XXVIIのN-オキシドがアミノ化されて、式Ibのエステル-置換された1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミンが得られる。生成物またはその薬学上許容可能な塩は、従来の方法を使用して単離できる。

【0120】

反応スキーム5

【化34】



10

【0121】

反応スキーム6

式I-3bのケトンは、 $R_{1-1}$ 、 $R_2$ 、 $R_A$ 、 $R_B$ 、およびXが上で定義されるとおりであり、Phがフェニルである反応スキーム6に従って調製できる。反応スキーム6のステップ(1)では、式XXXの2,4-ジクロロ-3-ニトロピリジンが式 $H_2N-X-C(O)-O$ -アルキルのアミノエステルまたはその塩酸塩と反応して、式XXXIの2-クロロ-3-ニトロピリジンが形成される。反応は、N,N-ジメチルホルムアミド(DMF)などの不活性溶剤中においてトリエチルアミンなどの塩基存在下で、式 $H_2N-X-C(O)-O$ -アルキル-HClのアミノエステルと、式XXXの2,4-ジクロロ-3-ニトロピリジンとを合わせて都合良く実施される。反応は周囲温度実施でき、生成物は従来の方法を使用して、反応混合物から単離できる。式XXXの多くの2,4-ジクロロ-3-ニトロピリジンが知られており、既知の合成方法を使用して容易に調製できる(例えばデラリア(Dellaria)ら、米国特許第6,525,064号明細書およびそこで参照される文献を参照されたい)。

20

30

【0122】

反応スキーム6のステップ(2)では、式XXXIの2-クロロ-3-ニトロピリジンがアルカリ金属アジ化物と反応して、式XXXIIの8-ニトロテトラゾロ[1,5-a]ピリジン-7-アミンが得られる。反応は、塩化セリウムIII、好ましくは塩化セリウムIII七水和物の存在下で、アセトニトリル/水、好ましくは90/10のアセトニトリル/水などの適切な溶剤中で、式XXXIの化合物を例えばアジ化ナトリウムなどのアルカリ金属アジ化物と合わせて実施できる。任意に反応は、例えば還流温度に加熱して実施できる。代案としては、反応は、DMFなどの適切な溶剤中で例えば約50~60に加熱して、任意に塩化アンモニウム存在下で、式XXXIの化合物を例えばナトリウムアジ化物などのアルカリ金属アジ化物と合わせて実施できる。生成物は従来の方法を使用して、反応混合物から単離できる。

40

【0123】

反応スキーム6のステップ(3)では、式XXXIIの8-ニトロテトラゾロ[1,5-a]ピリジン-7-アミンが還元されて式XXXIIIのテトラゾロ[1,5-a]ピリジン-7,8-ジアミンが得られる。還元は、例えば炭素上の白金または炭素上のパラジウムなどの従来の不均一水素付加触媒を使用して、水素付加によって実施できる。反応はアセトニトリルまたは酢酸エチルなどの適切な溶剤中において、パール装置上で都合良

50

く実施できる。生成物は従来の方法を使用して、反応混合物から単離できる。代案としては、還元は、反応スキーム 1 a のステップ ( 2 ) で述べられる 1 から 2 相の亜ジチオン酸ナトリウム還元を使用して実施できる。

## 【 0 1 2 4 】

反応スキーム 6 のステップ ( 4 ) では、式 X X X I I I のテトラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジン - 7 , 8 - ジアミンが、カルボン酸同等物と反応して、式 X X X I V の 7 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] テトラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジンが得られる。反応は、反応スキーム 1 a のステップ ( 3 ) で述べられるようにして実施でき、生成物は従来の方法を使用して、反応混合物から単離できる。

## 【 0 1 2 5 】

反応スキーム 6 のステップ ( 5 ) では、式 X X X I V の 7 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] テトラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジンのエステル基がワインレブアミドに転換され、式 X X X V の 7 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] テトラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジンが得られる。転換は、反応スキーム 4 のステップ ( 4 ) で述べられるようにして実施でき、生成物は従来の方法を使用して、反応混合物から単離できる。

10

## 【 0 1 2 6 】

反応スキーム 6 のステップ ( 6 ) では、式 X X X V のワインレブアミドが式  $R_{1-1}Mg$  ハロゲン化物のグリニヤール試薬で処理され、式 X X X V I のケトンが形成される。グリニヤール反応は、反応スキーム 1 a のステップ ( 5 ) で述べられるようにして実施でき、生成物は従来の方法を使用して、反応混合物から単離できる。

20

## 【 0 1 2 7 】

反応スキーム 6 のステップ ( 7 ) では、式 X X X V I の 7 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] テトラゾロ [ 1 , 5 - a ] ピリジンがトリフェニルホスフィンと反応して、式 X X X V I I の N - トリフェニルホスフィニル中間体が形成される。トリフェニルホスフィンとの反応は、窒素雰囲気下で例えば還流温度に加熱して、トルエンまたは 1 , 2 - ジクロロベンゼンなどの適切な溶剤中で実施できる。生成物は従来の方法を使用して、反応混合物から単離できる。

## 【 0 1 2 8 】

反応スキーム 6 のステップ ( 8 ) では、式 X X X V I I の N - トリフェニルホスフィニル中間体が加水分解されて、式 I - 3 b のケトン置換された 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 4 - アミンが得られる。加水分解は、例えば酸の存在下で低級アルカノール中で加熱して、当業者によく知られている一般方法によって実施できる。生成物は、式 I - 3 b の化合物またはその薬学上許容可能な塩として、従来の方法を使用して反応混合物から単離できる。

30

## 【 0 1 2 9 】

( Z が - C ( O ) O - ) である式 I - 3 のエステルは、ステップ ( 5 ) および ( 6 ) を割愛して調製できる。

## 【 0 1 3 0 】

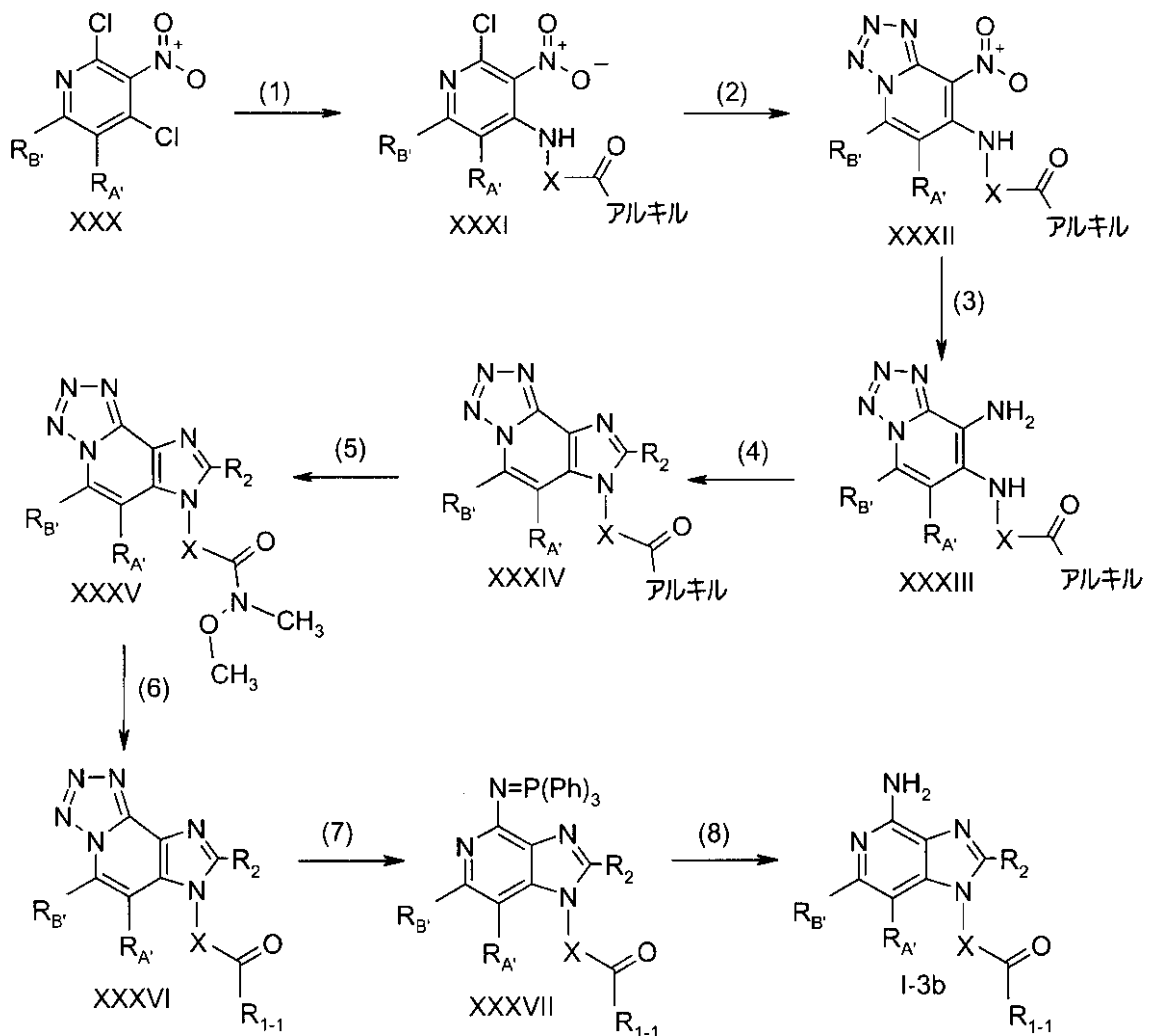
Z が - C ( O ) - であり、 $R_{1-1}$  が - N ( C H <sub>3</sub> ) ( O C H <sub>3</sub> ) である式 I - 3 のワインレブアミドは、ステップ ( 5 ) の方法を使用して式 I - 3 のエステルから調製できる。

40

## 【 0 1 3 1 】

反応スキーム 6

## 【化 3 5】



## 【0132】

## 反応スキーム 7

式 I - 4 b のケトン は反応スキーム 7 に従って調製でき、ここでは  $R_b$  はアルキル、アルコキシ、または  $-N(R_9)_2$  であり、 $R_{2b}$ 、 $R_{1-1b}$ 、および  $X_b$  は  $R_2$ 、 $R_{1-1}$  のサブセットであり、 $X$  は上で定義されるとおりで、当業者が反応の酸性水素付加条件下で還元を被りやすいと認識する置換基を含まない。これらの還元を被りやすい基としては、例えばアルケニル、アルキニル、およびアリール基、およびニトロ置換基を有する基が挙げられる。

## 【0133】

反応スキーム 7 のステップ (1) では、式 X I b の 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリンが式 X X X V I I I b の 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミンに転換される。転換は、反応スキーム 1 a のステップ (7) および (8) で述べられるようにして実施でき、生成物は従来の方法を使用して、反応混合物から単離できる。

## 【0134】

反応スキーム 7 のステップ (2) では、式 X X X V I I I b の 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミンが式 X X X I X b の 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミンに還元される。反応は不均一水素付加条件下で、白金 ( I V ) オキシドをトリフルオロ酢酸中の式 X X X V I I I b の化合物の溶液に

添加して、反応を水素圧力下に置いて都合良く実施される。反応は、周囲温度でパール装置上で実施できる。生成物は従来の方法を使用して、反応混合物から単離できる。

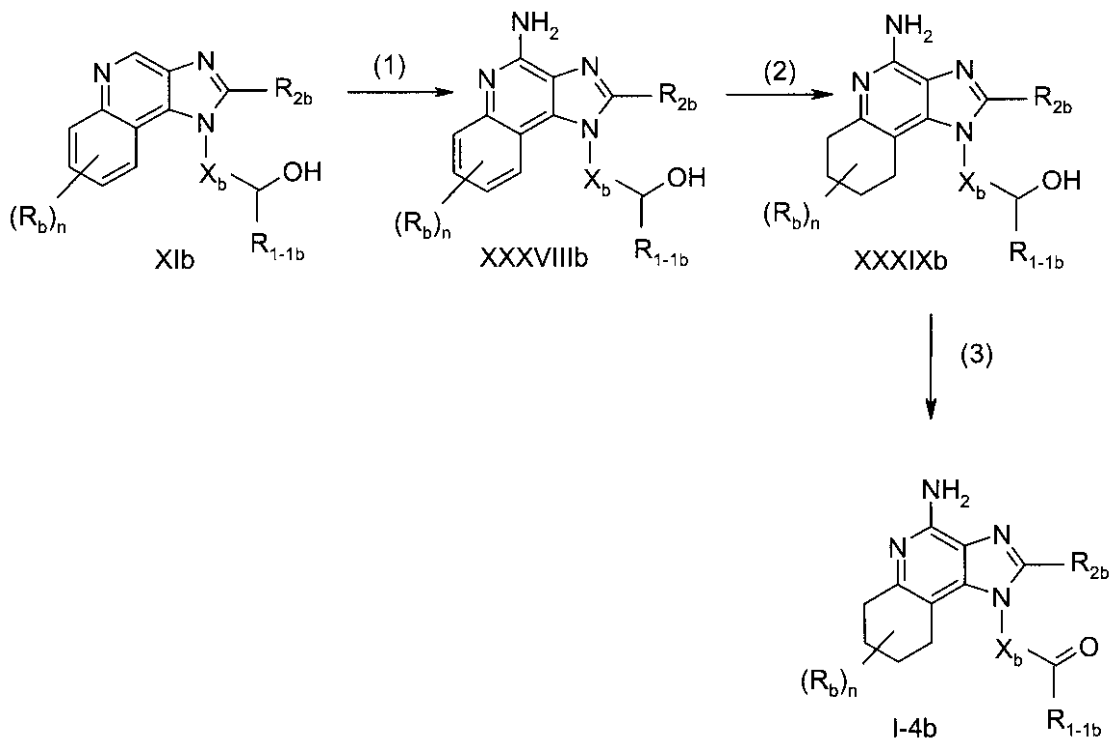
【0135】

反応スキーム7のステップ(3)では、式XXXIXbのアルコール-置換された6,7,8,9-テトラヒドロ-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミンが、式I-4bのケトン-置換された6,7,8,9-テトラヒドロ-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミンに酸化される。酸化は、反応スキーム1aのステップ(4)で述べられるようにして実施できる。生成物またはその薬学上許容可能な塩は、従来の方法によって単離できる。

【0136】

反応スキーム7

【化36】



【0137】

本発明の化合物はまた、反応スキーム1~7で示される合成経路のバリエーションを使用して調製でき、それは当業者には明らかである。例えば式Ia、I-3b、およびI-4bのケトンは、反応スキーム(3)のステップ(1)で述べられる方法を使用して、ケタールに転換できる。本発明の化合物はまた、下の実施例で述べられる合成経路を使用して調製できる。

【0138】

医薬組成物および生物学的活性

本発明の医薬組成物は、上述のように薬学上許容可能なキャリアとの組み合わせで、治療的に有効量の本発明の化合物または塩を含有する。

【0139】

「治療的な有効量」および「有効量」という用語は、サイトカイン誘導、免疫調節、抗腫瘍活性、および/または抗ウイルス活性などの治療的または予防的な効果を誘導するのに十分な化合物または塩の量を意味する。本発明の医薬組成物で使用される活性化合物または塩の正確な量は、化合物または塩の物理的および化学的性質、キャリアの性質、およ

10

20

30

40

50

び意図される投与計画などの当業者に既知の要素次第で変化するが、本発明の組成物は、対象にキロ当たり約100ナノグラム( $\text{ng}/\text{kg}$ )~キロ当たり約50ミリグラム( $\text{mg}/\text{kg}$ )、好ましくはキロ当たり約10マイクログラム( $\mu\text{g}/\text{kg}$ )~約5 $\text{mg}/\text{kg}$ の化合物または塩の用量を提供するのに十分な活性成分を含有することが予期される。錠剤、トローチ剤、カプセル、非経口調合物、シロップ、クリーム、軟膏、煙霧剤調合物、経皮パッチ、経粘膜パッチなどの多様な剤形を使用してもよい。

【0140】

本発明の化合物または塩は、処置計画において単一治療的薬として投与でき、または本発明の化合物または塩は、互いに組み合わせ、または追加的免疫応答調節物質、抗ウイルス剤、抗生物質、抗体、タンパク質、ペプチド、オリゴヌクレオチドなどをはじめとするその他の活性薬剤との組み合わせで投与されてもよい。

10

【0141】

本発明の化合物または塩は、下に記載する試験に従って実施された実験において、特定のサイトカインの生成を誘導することが示されている。これらの結果は、化合物または塩が、いくつかの異なるやり方で免疫応答を調節できる免疫応答調節物質として有用であることを示唆し、それらを多様な疾患の処置において有用なものにする。

【0142】

本発明の化合物または塩の投与によって生成が誘導される場合があるサイトカインとしては、概してインターフェロン-( $\text{IFN}$ -)および/または腫瘍壊死因子-( $\text{TNF}$ -)ならびに特定のインターロイキン( $\text{IL}$ )が挙げられる。本発明の化合物または塩によって生合成が誘導される場合があるサイトカインとしては、 $\text{IFN}$ -、 $\text{TNF}$ -、 $\text{IL}$ -1、 $\text{IL}$ -6、 $\text{IL}$ -10、および $\text{IL}$ -12、および多様なその他のサイトカインが挙げられる。いくつかある効果の中でも特に、これらおよびその他のサイトカインはウイルス生成および腫瘍細胞生育を阻害でき、化合物または塩をウイルス性疾患および新生物疾患の処置において有用なものにする。したがって本発明は、有効量の本発明の化合物または塩または組成物を動物に投与するステップを含んでなる、動物においてサイトカイン生合成を誘導する方法を提供する。サイトカイン生合成誘導のために化合物または塩または組成物が投与される動物は、下で述べられるように、例えばウイルス性疾患または新生物疾患などの疾患を有しても良く、化合物または塩の投与が治療的な処置を提供しても良い。代案としては化合物または塩の投与が予防的な処置を提供するように、動物が疾患にかかる前に、化合物または塩が動物に投与されてもよい。

20

30

【0143】

サイトカインの生成を誘導する能力に加えて、本発明の化合物または塩は、生得免疫応答のその他の側面に影響できる。例えばサイトカイン誘導による場合がある効果として、ナチュラルキラー細胞活性が刺激されてもよい。化合物または塩はまた、マクロファージを活性化してもよく、それは次に酸化窒素の分泌および追加的サイトカインの生成を刺激する。さらに化合物または塩は、B-リンパ球の増殖および分化を引き起こしても良い。

【0144】

本発明の化合物または塩はまた、獲得免疫応答に対効果を有することができる。例えば化合物または塩の投与に際して、Tヘルパータイプ1( $\text{T}_{\text{H}1}$ )サイトカイン $\text{IFN}$ -の生成が直接誘導されてもよく、Tヘルパータイプ2( $\text{T}_{\text{H}2}$ )サイトカイン $\text{IL}$ -4、 $\text{IL}$ -5および $\text{IL}$ -13の生成が阻害されてもよい。

40

【0145】

疾患の予防または治療的処置のためか、生得または獲得免疫をもたらすためかに関わらず、化合物または塩または組成物は、単独でまたは例えばワクチンアジュバントにおける場合のように、1つ以上の活性構成要素との組み合わせで投与されてもよい。その他の構成要素と共に投与される場合、化合物または塩およびその他の構成要素または構成要素は、別々に投与されても、溶液中などで一緒にしかし独立して投与されても、または例えばコロイド懸濁液中などで(a)共有結合的に結合する、または(b)非共有結合的に結合するなどして一緒に互いに結合して投与されてもよい。

50

## 【 0 1 4 6 】

ここで同定された化合物または塩が処置として使用されてもよい病状としては、以下が挙げられるが、これに限定されるものではない。

( a ) 例えばアデノウイルス、ヘルペスウイルス ( 例えば HSV - I、HSV - II、CMV、または VZV )、ポックスウイルス ( 例えば痘瘡またはワクシニア、または伝染性軟属腫などのオルトポックスウイルス )、ピコルナウイルス ( 例えばライノウイルスまたはエンテロウイルス )、オルソミクソウイルス ( 例えばインフルエンザウイルス )、パラミクソウイルス ( 例えばライノウイルス、おたふく風邪ウイルス、はしかウイルス、および呼吸器合胞体ウイルス ( RSV ) )、コロナウイルス ( 例えば SARS )、パポバウイルス ( 例えば生殖器疣、尋常性疣贅、または足底疣贅を引き起こすものなどの乳頭腫ウイルス )、ヘパドナウイルス ( 例えば肝炎 B ウイルス )、フラビウイルス ( 例えば肝炎 C ウイルスまたはデングウイルス )、またはレトロウイルス ( 例えば HIV などのレンチウイルス ) による感染に起因する疾患などのウイルス性疾患、

( b ) 例えばエシェリキア ( Escherichia )、エンテロバクター ( Enterobacter )、サルモネラ ( Salmonella )、ブドウ球菌 ( Staphylococcus )、赤痢菌 ( Shigella )、リステリア ( Listeria )、アエロバクター ( Aerobacter )、ヘリコバクター ( Helicobacter )、クレブシエラ ( Klebsiella )、プロテウス ( Proteus )、シュードモナス ( Pseudomonas )、連鎖球菌 ( Streptococcus )、クラミジア ( Chlamydia )、マイコプラズマ ( Mycoplasma )、肺炎球菌 ( Pneumococcus )、ナイセリア ( Neisseria )、クロストリジウム ( Clostridium )、バシラス ( Bacillus )、コリネバクテリウム ( Corynebacterium )、マイコバクテリウム ( Mycobacterium )、カンピロバクター ( Campylobacter )、ビブリオ ( Vibrio )、セラチア ( Serratia )、プロビデンシア ( Providencia )、クロモバクテリウム ( Chromobacterium )、ブルセラ ( Brucella )、エルシニア ( Yersinia )、ヘモフィルス ( Haemophilus )、またはボルデテラ ( Bordetella ) 属の細菌による感染に起因する疾患などの細菌性疾患、

( c ) クラミジア、カンジダ症、アスペルギルス症、ヒストプラズマ症、クリプトコックス髄膜炎をはじめとするが、これに限定されるものではない真菌性疾患、またはマラリア、ニューモシスティスカリニ肺炎、レーシュマニア症、クリプトスポリジウム症、トキソプラズマ症、およびトリパノソーマ感染をはじめとするが、これに限定されるものではない寄生虫疾患などのその他の感染疾患、

( d ) 上皮内新生物形成と、子宮頸部異形成と、光線性角化症と、基底細胞癌と、扁平細胞癌と、腎細胞癌と、カポジ肉腫と、メラノーマと、骨髄性白血病、慢性リンパ性白血病、多発性骨髄腫、非ホジキンリンパ腫、皮膚の T - 細胞リンパ腫、B - 細胞リンパ腫、および毛様細胞白血病をはじめとするがこれに限定されるものではない白血病と、その他の癌などの新生物疾患、

( e ) アトピー性皮膚炎または湿疹、好酸球増加症、喘息、アレルギー、アレルギー性鼻炎、およびオーメン症候群などの  $T_H2$  - 媒介アトピー性疾患、

( f ) 全身性エリテマトーデス、本態性血小板血症、多発性硬化症、円板状エリテマトーデス、円形脱毛症などの特定の自己免疫疾患、および

( g ) 例えばケロイド形成およびその他のタイプの癬痕 ( 例えば慢性創傷をはじめとする創傷治癒の増強 ) の阻害などの創傷修復に関する疾患。

## 【 0 1 4 7 】

さらに本発明の化合物または塩は、例えば BCG、コレラ、ペスト、腸チフス、肝炎 A、肝炎 B、肝炎 C、インフルエンザ A、インフルエンザ B、ライノウイルス、ポリオ、狂犬病、はしか、おたふく風邪、風疹、黄熱病、破傷風、ジフテリア、ヘモフィルスインフルエンザ b、結核、髄膜炎菌性および肺炎球菌ワクチン、アデノウイルス、HIV、水痘、サイトメガロウイルス、デング、ネコ白血病、家禽ペスト、HSV - 1 および HS

10

20

30

40

50

V - 2、豚コレラ、日本脳炎、呼吸器合胞体ウイルス、ロタウイルス、乳頭腫ウイルス、黄熱病、およびアルツハイマー疾患に関連して、例えば生ウイルス性、細菌性、または寄生虫性免疫原と、不活性化ウイルス性、腫瘍由来、原生動物性、生物体由来、真菌性、または細菌性免疫原、類毒素、毒素と、自己 - 抗原と、多糖類と、タンパク質と、糖タンパク質と、ペプチドと、細胞ワクチンと、DNA ワクチンと、自家性ワクチンと、リコンビナントタンパク質などに対する体液性および / または細胞媒介免疫応答のいずれかを生じさせるあらゆる物質との組み合わせで使用するためのワクチンアジュバントとして有用な場合がある。

【0148】

本発明の化合物または塩は、免疫機能が損なわれている個体において特に役立つ場合がある。例えば化合物または塩は、例えば移植患者、癌患者、および HIV 患者において、細胞媒介免疫の抑制後に生じる日和見感染および腫瘍を処置するために使用されてもよい。

10

【0149】

したがって例えば動物に対して治療的に有効量の本発明の化合物または塩を投与することで、それを必要とする（疾患がある）動物において、ウイルス性疾患または新生物疾患などの上記の1つ以上の疾患または数タイプの疾患を処置しても良い。

【0150】

サイトカイン合成を誘導するのに効果的な化合物または塩の量は、単球、マクロファージ、樹状細胞、および B - 細胞などの1つ以上の細胞タイプに、例えばこのようなサイトカインの背景レベルに比べて増大された（誘導された）IFN - 、TNF - 、IL - 1、IL - 6、IL - 10 および IL - 12 などの1つ以上のサイトカインの量を生成させるのに十分な量である。正確な量は技術分野で既知の要素次第で変化するが、約 100 ng / kg ~ 約 50 mg / kg、好ましくは約 10 μg / kg ~ 約 5 mg / kg の用量であることが期待される。本発明はまた、動物に有効量の本発明の化合物または塩または組成物を投与するステップを含んでなる、動物においてウイルス性感染を処置する方法、および動物において新生物疾患を処置する方法も提供する。ウイルス性感染を処置または阻害するのに効果的な量は、未処置の対照動物と比較して、ウイルス性病変、ウイルス負荷、ウイルス生成速度、および死亡率などの1つ以上のウイルス性感染発現の低下を引き起こす量である。このような処置に効果的である正確な量は、技術分野で既知の要素次第

20

30

【実施例】

【0151】

以下の実施例によって本発明の目的および利点をさらに例証するが、これらの実施例で述べる特定の物質およびその量、ならびにその他の条件および詳細は、本発明を不当に制限するものではない。

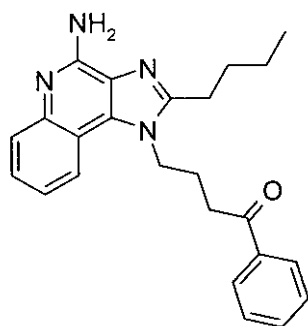
40

【0152】

実施例 1

4 - (4 - アミノ - 2 - ブチル - 1 H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリン - 1 - イル) - 1 - フェニルブタン - 1 - オン

## 【化 3 7】



10

## ステップ 1 :

ジクロロメタン (700 mL) 中の 4 - クロロ - 3 - ニトロキノリン (100.0 g、479 mmol) およびトリエチルアミン (72.8 g、719 mmol) の攪拌される混合物に、4 - アミノ - 1 - ブタノール (42.7 g、479 mmol) を滴下して添加した。添加完了後、反応混合物に水 (500 mL) を添加して生成物を沈殿させた。より多くの水 (2 L) を添加して混合物を一晩攪拌し、次に濾過した。有機溶液を硫酸ナトリウム上で乾燥させて減圧下で濃縮し、濾過によって単離された生成物と組み合わせて、4 - (3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ) ブタン - 1 - オール (113 g) を淡黄色の固形物として得た。

20

## 【0153】

## ステップ 2 :

クロロホルム (900 mL) 中の 4 - (3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ) ブタン - 1 - オール (70.0 g、268 mmol) およびトリエチルアミン (54.2 g、536 mmol) の攪拌される溶液に、tert - ブチルジメチルシリル塩化 (TBDMSCl、60.6 g、402 mmol) を添加した。3.5 時間後、追加的なトリエチルアミン (19.0 g、188 mmol) および TBDMSCl (20.2 g、134 mmol) を添加して、混合物を一晩攪拌した。追加的な TBDMSCl (4.0 g、27 mmol) の添加後、薄層クロマトグラフィー (TLC) によって判定されて反応が完了した。クロロホルム (900 mL) を添加し、混合物を各 360 mL の 0.10 N 塩酸溶液、飽和水性重炭酸ナトリウム溶液、および鹼水で連続的に洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濾過して溶剤を蒸発させると [4 - (tert - ブチルジメチルシラニルオキシ) ブチル] (3 - ニトロ - キノリン - 4 - イル) アミンおよび tert - ブチルジメチルシラノール (総量 117 g、約 65 : 35 mol : mol) の混合物が残り、これをさらに精製することなく次のステップで使用した。

30

## 【0154】

## ステップ 3 :

先のステップからの [4 - (tert - ブチルジメチルシラニルオキシ) ブチル] (3 - ニトロ - キノリン - 4 - イル) アミンおよび tert - ブチルジメチルシラノール (110 g) の混合物をトルエン (880 mL) に溶解し、炭素上の 5% 白金触媒 (3.0 g) と共にパール水素付加容器内に入れた。容器を 50 psi (3.4 × 10<sup>5</sup> Pa) 水素に加圧して、パール装置上で 1.5 時間振盪し、時折追加的な水素を添加して圧力を 50 psi (3.4 × 10<sup>5</sup> Pa) に維持した。3 時間後、CELITE 濾材を通して反応混合物を濾過し、減圧下で濃縮して N<sup>4</sup> - [4 - (tert - ブチルジメチルシラニルオキシ) ブチル] キノリン - 3,4 - ジアミンを暗色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

40

## 【0155】

## ステップ 4 :

50

トルエン(200 mL)中の $N^4$ -[4-(tert-ブチルジメチルシラニルオキシ)ブチル]キノリン-3,4-ジアミン(62.9 g、182 mmol)およびオルト吉草酸トリメチル(45.2 g、278 mmol)の溶液を加熱して2時間還流させ、次に減圧下で濃縮し、2-ブチル-1-[4-(tert-ブチルジメチルシラニルオキシ)ブチル]-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリンを油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

【0156】

ステップ5:

先のステップからの2-ブチル-1-[4-(tert-ブチルジメチルシラニルオキシ)ブチル]-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリンおよびテトラブチルアンモニウムフッ化物(142 mLのテトラヒドロフラン中の1 M溶液)をテトラヒドロフラン(THF)(400 mL)に溶解し、1時間攪拌して、次に減圧下で濃縮して、シリカゲル上でのクロマトグラフィー(ジクロロメタン中10%メタノールでの溶出)後に、4-(2-ブチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ブタン-1-オール(20.0 g)を淡褐色固形物として得た。

【0157】

ステップ6:

ジクロロメタン(130 mL)中のジメチルスルホキシド(DMSO、7.88 g、101 mmol)の溶液をドライアイス/アセトン浴内で冷却し、攪拌した。塩化オキサリル(9.40 g、74 mmol)、続いてジクロロメタン(320 mL)中の4-(2-ブチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ブタン-1-オール(20.0 g、67.3 mmol)の溶液を滴下して添加した。5分後トリエチルアミン(20.42 g、202 mmol)を添加して、混合物が室温に暖まるまで放置した。クロロホルム(500 mL)の添加後、混合物を飽和塩化アンモニウム溶液(200 mL)および飽和水性重炭酸ナトリウム溶液(200 mL)で連続的に洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濾過して暗色固形物に濃縮した。この固形物を微細な固形物が得られるまでジエチルエーテル中でスラリーにした。生成物を濾過して乾燥させ、4-(2-ブチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ブチルアルデヒド(17.9 g)を淡褐色固形物として得た。

【0158】

ステップ7:

無水THF(270 mL)中の4-(2-ブチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ブチルアルデヒド(8.0 g、27.1 mmol)の攪拌される溶液に、フェニル臭化マグネシウム溶液(27.08 mLのTHF中の1 M溶液)を滴下して添加した。30分後、溶液を飽和塩化アンモニウム(100 mL)でクエンチし、酢酸エチル(300 mL)で希釈して、層を分離させた。有機溶液を飽和水性重炭酸ナトリウム溶液(100 mL)および鹼水(100 mL)で連続的に洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濾過して淡いオレンジ色の油に濃縮した。シリカゲル上でのクロマトグラフィー(ジクロロメタン中の5%メタノールによる溶出)から、4-(2-ブチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)-1-フェニルブタン-1-オール(4.3 g)を淡いオレンジのガム様固形物として得た。

【0159】

ステップ8:

ジクロロメタン(22 mL)中のDMSO(1.35 g、17.3 mmol)の溶液をドライアイス/アセトン浴内で冷却し、攪拌した。塩化オキサリル(1.61 g、12.7 mmol)、続いてジクロロメタン(55 mL)中の4-(2-ブチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)-1-フェニルブタン-1-オール(4.3 g、11.5 mmol)の溶液を滴下して添加した。5分後トリエチルアミン(3.49 g、34.5 mmol)を添加し、混合物が室温に暖まるまで放置した。クロロホルム(300 mL)の添加後、混合物を飽和塩化アンモニウム溶液(100 mL)および飽和水性重

10

20

30

40

50

炭酸ナトリウム溶液 (100 mL) で連続的に洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濾過して濃縮して 4 - (2 - ブチル - 1 H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリン - 1 - イル) - 1 - フェニルブタン - 1 - オン (4.15 g) を灰白色の固形物として得た。

【0160】

ステップ 9 :

クロロホルム (56 mL) 中の 4 - (2 - ブチル - 1 H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリン - 1 - イル) - 1 - フェニルブタン - 1 - オン (4.15 g、11.2 mmol) の攪拌される溶液に、3 - クロロペルオキシ安息香酸 (m - CPBA、およそ 77% 純度、2.75 g、12.3 mmol) を数分間かけて小分けして添加した。1 時間後、TLC による判定で反応が完了していなかったため、m - CPBA (1.0 g) の追加的装填を添加した。30 分間攪拌した後、混合物をクロロホルム (200 mL) で希釈し、飽和水性重炭酸ナトリウム溶液 (2 × 100 mL) および鹼水 (100 mL) で連続的に洗浄した、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濾過して濃縮して 4 - (2 - ブチル - 5 - オキシド - 1 H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリン - 1 - イル) - 1 - フェニルブタン - 1 - オンを暗色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

【0161】

ステップ 10 :

先のステップからのジクロロメタン (49 mL) 中の 4 - (2 - ブチル - 5 - オキシド - 1 H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリン - 1 - イル) - 1 - フェニルブタン - 1 - オン および水酸化アンモニウム (16 mL) の激しく攪拌される混合物に、塩化 p - トルエンスルホニル (2.34 g、12.3 mmol) を小分けして数分間かけて添加した。15 分後、反応混合物をクロロホルム (200 mL) および飽和水性重炭酸ナトリウム溶液 (100 mL) で希釈した。層が分離し、有機相を飽和水性重炭酸ナトリウム溶液 (100 mL) で再度洗浄した。次に水性部分をクロロホルム (50 mL) で逆抽出した。有機物を合わせて硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濾過して暗色黄色固形物に濃縮した。暗色黄色固形物をジエチルエーテル中でスラリーにし、濾過したところ微細な灰白色の固形物が形成した。この固形物を N, N - ジメチルホルムアミド (DMF) および水から再結晶化して、4 - (4 - アミノ - 2 - ブチル - 1 H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリン - 1 - イル) - 1 - フェニルブタン - 1 - オンを融点 178 ~ 180 の灰白色の飛散性固形物として得た。

MS (APCI) m/z 387 (M + H)<sup>+</sup>;

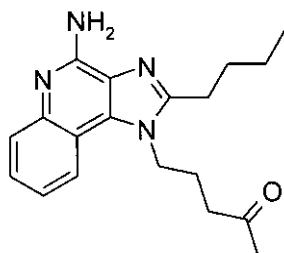
C<sub>24</sub>H<sub>26</sub>N<sub>4</sub>O の分析計算値 : C, 74.58; H, 6.78; N, 14.50。実測値 : C, 74.45; H, 6.77; N, 14.47。

【0162】

実施例 2

5 - (4 - アミノ - 2 - ブチル - 1 H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリン - 1 - イル) ペンタン - 2 - オン

【化 38】



ステップ 1 ~ 6 は実施例 1 の調製について上述したようにして実施した。

【0163】

## ステップ 7 :

実施例 1 のステップ 7 で述べられる一般方法を使用して、4 - ( 2 - ブチル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ブチルアルデヒド ( 8 . 5 g 、 2 8 . 8 m m o l ) と臭化メチルマグネシウム ( 2 0 . 6 m L のトルエン / T H F 中の 1 . 4 M 溶液、 2 8 . 8 m m o l ) とを反応させて、シリカゲル上のクロマトグラフィー ( ジクロロメタン中の 5 % メタノールでの溶出 ) 後に、5 - ( 2 - ブチル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オール ( 3 . 5 4 g ) を灰白色の固形物として得た。

【 0 1 6 4 】

## ステップ 8 :

実施例 1 のステップ 8 で述べられる一般方法を使用して、5 - ( 2 - ブチル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オール ( 3 . 5 4 g 、 1 1 . 4 m m o l ) を D M S O ( 1 . 3 3 g 、 1 7 . 1 m m o l ) 、塩化オキサリル ( 1 . 5 9 g 、 1 2 . 5 m m o l ) 、およびトリエチルアミン ( 3 . 4 5 g 、 3 4 . 1 m m o l ) で酸化して、5 - ( 2 - ブチル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オン ( 2 . 1 5 g ) を暗色固形物として得た。

【 0 1 6 5 】

## ステップ 9 および 1 0 :

実施例 1 のステップ 9 および 1 0 で述べられる一般方法を使用して、m - C P B A ( 1 . 7 1 g 、 7 . 6 4 m m o l ) との反応によって 5 - ( 2 - ブチル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オン ( 2 . 1 5 g 、 6 . 9 5 m m o l ) をアミノ化して 5 - ( 2 - ブチル - 5 - オキシド - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オンを得て、続いて塩化 p - トルエンスルホニル ( 1 . 4 6 g 、 7 . 6 4 m m o l ) および水酸化アンモニウム溶液 ( 1 0 m L ) との反応によって 5 - ( 4 - アミノ - 2 - ブチル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オンを融点 1 7 3 ~ 1 7 6 の灰白色の固形物として得た。

M S ( A P C I ) m / z 3 2 5 ( M + H ) <sup>+</sup> ;

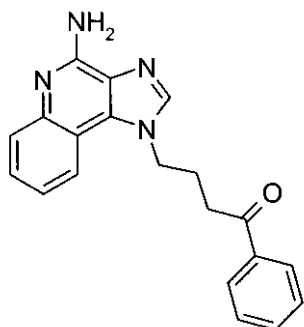
C<sub>19</sub>H<sub>24</sub>N<sub>4</sub>O の分析計算値 : C , 7 0 . 3 4 ; H , 7 . 4 6 ; N , 1 7 . 2 7 。実測値 : C , 7 0 . 2 4 ; H , 7 . 3 7 ; N , 1 7 . 2 5 。

【 0 1 6 6 】

## 実施例 3

4 - ( 4 - アミノ - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - 1 - フェニルブタン - 1 - オン

【 化 3 9 】



ステップ 1 ~ 3 は実施例 1 の調製について上述したようにして実施した。

【 0 1 6 7 】

## ステップ 4 :

トルエン ( 2 0 0 m L ) 中の N<sup>4</sup> - [ 4 - ( t e r t - ブチルジメチルシラニルオキシ

）ブチル]キノリン-3,4-ジアミン(101g、293mmol)およびオルトギ酸トリエチル(43.4g、293mmol)の混合物を加熱して2時間還流し、次に減圧下で濃縮して1-[4-(tert-ブチルジメチルシラニルオキシ)ブチル]-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリンを油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

【0168】

ステップ5:

先のステップからの1-[4-(tert-ブチルジメチルシラニルオキシ)ブチル]-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン(46.0g、129mmol)およびフッ化テトラブチルアンモニウム(142mLのTHF中の1M溶液)をTHF(400mL)に溶解して、1時間攪拌し、次に減圧下で濃縮してシリカゲル上でのクロマトグラフィー(ジクロロメタン中の10%メタノールでの溶出)後に、4-(1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ブタン-1-オール(20.0g)を淡褐色固形物として得た。

10

【0169】

ステップ6:

実施例1のステップ6で述べられる一般方法を使用して、4-(1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ブタン-1-オール(20.0g、82.9mmol)をDMSO(48.6g、620mmol)、塩化オキサリル(58.0g、456mmol)、およびトリエチルアミン(126g、1.25mol)で酸化して、シリカゲル上でのクロマトグラフィー(ジクロロメタン中の10%メタノールでの溶出)と、それに続くTHF(50mL)および水(20mL)の混合物中のトリフルオロ酢酸(0.10g、1mmol)での短時間の処置後に、4-(1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ブチルアルデヒド(10.0g)を明るいオレンジ色の油として得た。

20

【0170】

ステップ7:

実施例1のステップ7で述べられる一般方法を使用して、4-(1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ブチルアルデヒド(7.94g、33.2mmol)とフェニル臭化マグネシウム(33.2mLのTHF中の1M溶液、33.2mmol)とを反応させて、4-(1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)-1-フェニルブタン-1-オール(7.2g)を灰白色の固形物として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

30

【0171】

ステップ8:

実施例1のステップ6で述べられる一般方法によって、4-(1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)-1-フェニルブタン-1-オール(7.2g、22.7mmol)をDMSO(2.70g、34.0mmol)、塩化オキサリル(3.20g、25.0mmol)、およびトリエチルアミン(6.90g、68.1mmol)で酸化し、シリカゲル上でのクロマトグラフィー(ジクロロメタン中の10%メタノールでの溶出)後に、4-(1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)-1-フェニルブタン-1-オン(4.08g)を淡黄色固形物として得た。

40

【0172】

ステップ9:

実施例1のステップ9および10で述べられる一般方法を使用して、m-CPBA(3.20g、14.2mmol)との反応によって4-(1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)-1-フェニルブタン-1-オン(4.08g、12.9mmol)をアミノ化し、4-(5-オキシド-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)-1-フェニルブタン-1-オンを得て、続いて塩化p-トルエンシルホニル(2.71g、14.2mmol)および水酸化アンモニウム溶液(22mL)との反応によって、4-(4-アミノ-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)-1-フェニ

50

ルプタン - 1 - オン) を融点 209 ~ 211 の白色針状晶として得た。

MS (APCI) m/z 331 (M+H)<sup>+</sup>;

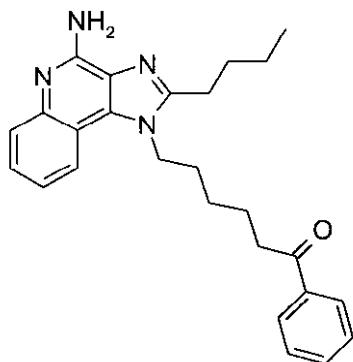
C<sub>20</sub>H<sub>18</sub>N<sub>4</sub>O の分析計算値: C, 72.71; H, 5.49; N, 16.96。実測値: C, 72.60; H, 5.39; N, 16.98。

【0173】

実施例 4

6 - (4 - アミノ - 2 - ブチル - 1H - イミダゾ [4,5 - c] キノリン - 1 - イル) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オン

【化 40】



ステップ 1:

ジクロロメタン (370 mL) 中の 4 - クロロ - 3 - ニトロキノリン (50.0 g、240 mmol) およびトリエチルアミン (36.4 g、360 mmol) の攪拌される混合物に、6 - アミノ - 1 - ヘキサノール (28.1 g、240 mmol) を小分けして 10 分間かけて添加した。混合物を加熱して 35 分間還流し、冷却してクロロホルム (300 mL) で希釈した。溶液を水 (200 mL)、飽和水性重炭酸ナトリウム溶液 (200 mL)、および鹼水 (200 mL) で連続的に洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濾過して淡黄色固形物の 6 - (3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ) ヘキサン - 1 - オール (68.3 g) に濃縮し、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

【0174】

ステップ 2:

実施例 1 のステップ 6 で述べられる一般方法によって、ステップ 1 からのアルコールである 6 - (3 - ニトロ - キノリン - 4 - イルアミノ) ヘキサン - 1 - オール (10.0 g、34.6 mmol) を DMSO (4.05 g、51.8 mmol)、塩化オキサリル (4.83 g、38.0 mmol)、およびトリエチルアミン (10.5 g、104 mmol) で酸化して、6 - (3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ) ヘキサン (9.9 g) を淡黄色固形物として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

【0175】

ステップ 3:

実施例 1 のステップ 7 で述べられる一般方法によって、6 - (3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ) ヘキサノール (9.9 g、34.5 mmol) をフェニル臭化マグネシウム (36.2 mL の THF 中の 1 M 溶液、36.2 mmol) と反応させ、シリカゲル上でのクロマトグラフィー (1:1 の容積:容積比の酢酸エチルおよびヘキサンでの溶出) 後に、6 - (3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オール (4.4 g) を淡黄色固形物として得た。

【0176】

ステップ 4:

10

20

30

40

50

実施例 1 のステップ 6 で述べられる一般方法によって、6 - ( 3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ ) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オール ( 4 . 0 g、11 mmol ) を DMSO ( 1 . 28 g、16 . 4 mmol )、塩化オキサリル ( 1 . 53 g、12 . 0 mmol )、およびトリエチルアミン ( 3 . 32 g、32 . 8 mmol ) で酸化し、酸エチルからの再結晶化後に 6 - ( 3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ ) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オン ( 2 . 27 g ) を淡いオレンジ結晶として得た。

【 0177 】

ステップ 5 :

トルエン ( 60 mL ) 中の 6 - ( 3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ ) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オン ( 2 . 27 g、6 . 25 mmol ) および炭素上の 5 % 白金触媒 ( 0 . 50 g ) の混合物を 50 psi (  $3.4 \times 10^5$  Pa ) のパール振盪機上で 3 時間水素付加した。CELITE 濾材を通して濾過し、減圧下で濃縮した後、6 - ( 3 - アミノキノリン - 4 - イルアミノ ) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オン ( 2 . 09 g ) を暗黄色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

10

【 0178 】

ステップ 6 :

トルエン ( 50 mL ) 中の 6 - ( 3 - アミノキノリン - 4 - イルアミノ ) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オン ( 2 . 09 g、6 . 25 mmol ) およびオルト吉草酸トリメチル ( 1 . 52 g、9 . 37 mmol ) の溶液を加熱してディーンスタークトラップ下で 2 時間還流し、次に減圧下で濃縮して、6 - ( 2 - ブチル - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オン ( 2 . 19 g ) を暗赤色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

20

【 0179 】

ステップ 7 および 8 :

実施例 1 のステップ 9 および 10 で述べられる一般方法を使用して、m - CPBA ( 1 . 35 g、6 . 03 mmol ) との反応によって 6 - ( 2 - ブチル - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オン ( 2 . 19 g、5 . 48 mmol ) をアミノ化し、6 - ( 2 - ブチル - 5 - オキシド - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オンを得て、続いて塩化 p - トルエンスルホニル ( 1 . 15 g、6 . 03 mmol ) および水酸化アンモニウム溶液 ( 9 mL ) との反応によって、シリカゲル上でのクロマトグラフィー ( ジクロロメタン中の 10 % メタノールでの溶出 ) およびエタノールからの再結晶化後に、6 - ( 4 - アミノ - 2 - ブチル - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オン ( 0 . 50 g ) を融点 149 ~ 151 の白色固形物として得た。

30

MS ( APC I ) m / z 415 ( M + H )<sup>+</sup> ;

C<sub>26</sub>H<sub>30</sub>N<sub>4</sub>O の分析計算値 : C, 75 . 33 ; H, 7 . 29 ; N, 13 . 52。実測値 : C, 75 . 14 ; H, 7 . 13 ; N, 13 . 48。

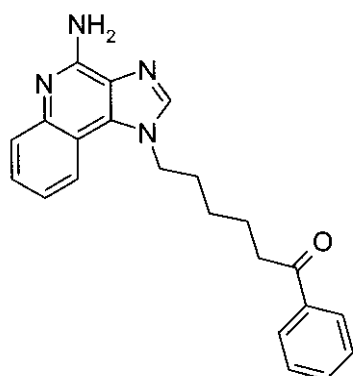
【 0180 】

実施例 5

6 - ( 4 - アミノ - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オン

40

## 【化 4 1】



10

## ステップ 1 :

実施例 4 のステップ 6 で述べられる一般方法によって、トルエン (26 mL) 中の 6 - (3 - アミノキノリン - 4 - イルアミノ) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オン (2.76 g、8.25 mmol)、トリメチルオルトギ酸 (1.5 g、9.9 mmol)、およびピリジン塩酸塩 (95 mg、0.83 mmol) の溶液をディーンスタークトラップ下で加熱して 2 時間還流し、次に減圧下で濃縮して、6 - (1H - イミダゾ [4,5 - c] キノリン - 1 - イル) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オンを暗色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

20

## 【0181】

## ステップ 2 :

実施例 1 のステップ 9 および 10 で述べられる一般方法を使用して、m - CPBA (1.44 g、6.41 mmol) との反応によって 6 - (1H - イミダゾ [4,5 - c] キノリン - 1 - イル) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オン (2.0 g、5.8 mmol) をアミノ化して、6 - (5 - オキシド - 1H - イミダゾ [4,5 - c] キノリン - 1 - イル) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オンを得て、続いて塩化 p - トルエンスルホニル (1.22 g、6.41 mmol) および水酸化アンモニウム溶液 (10 mL) との反応によって、シリカゲル上でのクロマトグラフィー (ジクロロメタン中の 5% メタノールでの溶出) およびジクロロエタンからの再結晶化後に、6 - (4 - アミノ - 1H - イミダゾ [4,5 - c] キノリン - 1 - イル) - 1 - フェニルヘキサン - 1 - オン (0.29 g) を融点 163 ~ 165 の灰白色の固形物として得た。

30

MS (APCI)  $m/z$  359 ( $M+H$ )<sup>+</sup>;

$C_{22}H_{22}N_4O$  の分析計算値 : C, 73.72; H, 6.19; N, 15.63。実測値 : C, 73.66; H, 5.88; N, 15.55。

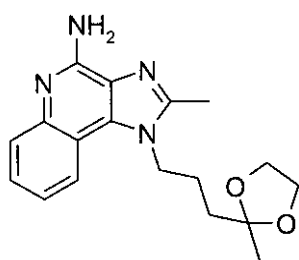
## 【0182】

## 実施例 6

2 - メチル - 1 - [3 - (2 - メチル - [1,3] ジオキソラン - 2 - イル) プロピル] - 1H - イミダゾ [4,5 - c] キノリン - 4 - アミン

40

## 【化 4 2】



10

## ステップ 1 :

実施例 1 のステップ 1 で述べられる一般方法を使用して、ジクロロメタン中で、4 - クロロ - 3 - ニトロキノリン (45.0 g、216 mmol)、3 - (2 - メチル - [1, 3] ジオキソラン - 2 - イル) プロピルアミン (37.0 g、255 mmol、PCT 公報国際公開第 01 / 51486 号パンフレットで述べられるようにして調製される) およびトリエチルアミン (37.0 g、366 mmol) を 15 時間反応させて、トルエン / ヘキサン混合物からの再結晶化後に、3 - (2 - メチル - [1, 3] ジオキソラン - 2 - イル) プロピル] - (3 - ニトロキノリン - 4 - イル) アミン (44.1 g) を黄色固形物として得た。

20

## 【0183】

## ステップ 2 :

先のステップからの生成物である [3 - (2 - メチル - [1, 3] ジオキソラン - 2 - イル) プロピル] (3 - ニトロ - キノリン - 4 - イル) アミン (29.5 g、93.0 mmol) をジクロロメタンおよび水 (各 375 mL) の混合物中のナトリウム垂ジチオン酸塩 (67.0 g、およそ 85% 純度)、炭酸カリウム (51.4 g、372 mmol)、およびエチルピオロゲン二臭化物 (0.37 g、1 mmol) と共に 15 時間撹拌した。次に層が分離して、有機相を飽和水性重炭酸ナトリウム溶液および水 (各 250 mL) で連続的に洗浄し、炭酸カリウム上で乾燥させ、濾過して減圧下で濃縮し、N<sup>4</sup> - [3 - (2 - メチル - [1, 3] ジオキソラン - 2 - イル) - プロピル] キノリン - 3, 4 - ジアミン (26.0 g) を暗色固形物として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

30

## 【0184】

## ステップ 3 :

トルエン (250 mL) 中の N<sup>4</sup> - [3 - (2 - メチル - [1, 3] ジオキソラン - 2 - イル) プロピル] キノリン - 3, 4 - ジアミン (6.20 g、21.6 mmol)、トリエチルオルト酢酸 (3.10 g、25.8 mmol) およびピリジニウム p - トルエンシルホネート (0.18 g、0.71 mmol) の溶液をディーンスタークトラップ下で加熱して 2 時間還流し、周期的に留出物を排出し、反応混合物に新鮮なトルエンを添加した。溶液を減圧下で濃縮し、残留物をジクロロメタン (150 mL) に取り込んで、飽和水性重炭酸ナトリウム溶液および水 (各 100 mL) で連続的に洗浄し、炭酸カリウム上で乾燥させ、濾過して減圧下で濃縮し、2 - メチル - 1 - [3 - (2 - メチル - [1, 3] ジオキソラン - 2 - イル) プロピル] - 1H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリン (6.70 g) を暗色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

40

## 【0185】

## ステップ 4 :

実施例 1 のステップ 9 および 10 で述べられる一般方法を使用して、m - CPBA (9.4 g) との反応によって 2 - メチル - 1 - [3 - (2 - メチル - [1, 3] ジオキソラン - 2 - イル) プロピル] - 1H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリン (6.70 g、21

50

5 mmol) をアミノ化して、2 - メチル - 1 - [ 3 - ( 2 - メチル - [ 1, 3 ] ジオキソラン - 2 - イル ) - プロピル ] - 5 - オキシド - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリンを得て、続いて塩化 p - トルエンスルホニル ( 7.20 g、37.8 mmol ) および水酸化アンモニウム溶液 ( 100 mL ) との反応によって、トルエンからの再結晶化後に 2 - メチル - 1 - [ 3 - ( 2 - メチル - [ 1, 3 ] ジオキソラン - 2 - イル ) プロピル ] - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 4 - アミン ( 3.9 g ) を融点 193 ~ 195 の灰白色の固形物として得た。

MS ( APCI ) m / z 327 ( M + H )<sup>+</sup> ;

C<sub>18</sub>H<sub>22</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub> の分析計算値 : C, 66.24 ; H, 6.79 ; N, 17.17。実測値 : C, 66.07 ; H, 6.58 ; N, 16.91。

【 0186 】

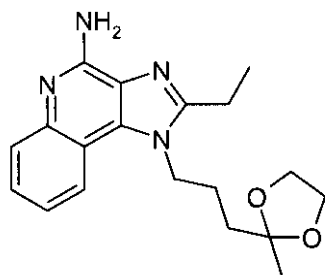
実施例 7、8、9、および 10 は実施例 6 について上述された一般方法によって調製され、下で述べられるオルトエステルまたは酸塩化物が、合成のステップ 3 のトリエチルオルト酢酸に置き換えられた。

【 0187 】

実施例 7

2 - エチル - 1 - [ 3 - ( 2 - メチル - [ 1, 3 ] ジオキソラン - 2 - イル ) プロピル ] - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 4 - アミン

【 化 43 】



実施例 6 のステップ 3 のトリエチルオルトプロピオネートを使用して、融点 195 ~ 196.5 の 2 - エチル - 1 - [ 3 - ( 2 - メチル - [ 1, 3 ] ジオキソラン - 2 - イル ) プロピル ] - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 4 - アミンを調製した。

MS ( APCI ) m / z 341 ( M + H )<sup>+</sup> ;

C<sub>19</sub>H<sub>24</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub> の分析計算値 : C, 67.04 ; H, 7.11 ; N, 16.46。実測値 : C, 66.77 ; H, 7.20 ; N, 16.41。

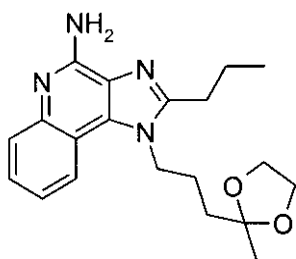
【 0188 】

実施例 8

1 - [ 3 - ( 2 - メチル - [ 1, 3 ] ジオキソラン - 2 - イル ) プロピル ] - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 4 - アミン

40

## 【化 4 4】



10

実施例 6 のステップ 3 のオルト酪酸トリメチルを使用して、融点 184 ~ 186 の 1 - [ 3 - ( 2 - メチル - [ 1 , 3 ] ジオキソラン - 2 - イル ) プロピル ] - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミンを調製した。

MS (APCI)  $m/z = 355 (M+H)^+$ ;

$C_{20}H_{26}N_4O_2$  の分析計算値 : C , 67.77 ; H , 7.39 ; N , 15.81。実測値 : C , 67.55 ; H , 7.45 ; N , 15.74。

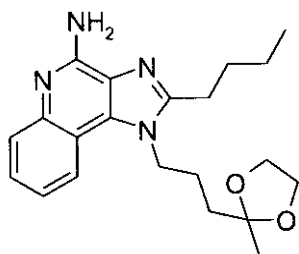
【 0 1 8 9 】

## 実施例 9

2 - ブチル - 1 - [ 3 - ( 2 - メチル - [ 1 , 3 ] ジオキソラン - 2 - イル ) プロピル ] - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミン

20

## 【化 4 5】



30

実施例 6 のステップ 3 のオルト吉草酸トリメチルを使用して、融点 169 ~ 171.5 の 2 - ブチル - 1 - [ 3 - ( 2 - メチル - [ 1 , 3 ] ジオキソラン - 2 - イル ) プロピル ] - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミンを調製した。

MS (APCI)  $m/z = 369 (M+H)^+$ ;

$C_{21}H_{28}N_4O_2 \cdot 0.9 H_2O$  の分析計算値 : C , 68.17 ; H , 7.67 ; N , 15.14。実測値 : C , 67.84 ; H , 7.69 ; N , 14.99。

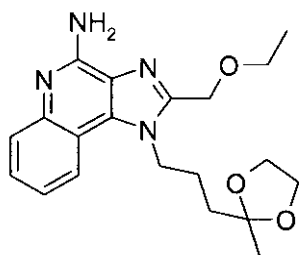
【 0 1 9 0 】

## 実施例 10

2 - エトキシメチル - 1 - [ 3 - ( 2 - メチル - [ 1 , 3 ] ジオキソラン - 2 - イル ) プロピル ] - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミン

40

## 【化 4 6】



10

実施例 6 のステップ 3 のトリエチルオルト酢酸およびピリジニウム p - トルエンスルホネートの代わりに、塩化エトキシアセチル ( 1 . 1 当量 ) およびトリエチルアミン ( 1 . 1 当量 ) を使用して、融点 150 ~ 152 の 2 - エトキシメチル - 1 - [ 3 - ( 2 - メチル - [ 1,3 ] ジオキソラン - 2 - イル ) プロピル ] - 1 H - イミダゾ [ 4,5 - c ] キノリン - 4 - アミンを調製した。

MS (APCI) m/z 371 (M+H)<sup>+</sup>;

C<sub>20</sub>H<sub>26</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub> の分析計算値 : C, 64.84; H, 7.07; N, 15.12。実測値 : C, 64.65; H, 7.13; N, 15.01。

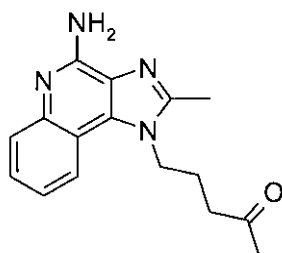
【0191】

20

実施例 11

5 - ( 4 - アミノ - 2 - メチル - 1 H - イミダゾ [ 4,5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オン

【化 4 7】



30

2 - メチル - 1 - [ 3 - ( 2 - メチル - [ 1,3 ] ジオキソラン - 2 - イル ) プロピル ] - 1 H - イミダゾ [ 4,5 - c ] キノリン - 4 - アミン ( 1.0 g、2.7 mmol ) に濃塩酸 ( 3 mL ) を添加し、全てが溶液になるまで混合物を数分間攪拌した。次に水 ( 5 mL ) を添加して、溶液を 1 時間室温で攪拌した。ジクロロメタン ( 75 mL ) および水 ( 25 mL ) の添加後、炭酸カリウム ( 10.0 g ) の緩慢な添加によって溶液を塩基性にした。層が分離し、有機層を飽和水性重炭酸ナトリウム溶液 ( 25 mL ) で洗浄し、炭酸カリウム上で乾燥させ、濾過して減圧下で濃縮し、融点 194 ~ 196 の 5 - ( 4 - アミノ - 2 - メチル - 1 H - イミダゾ [ 4,5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オンを得た。

40

MS (APCI) m/z 283 (M+H)<sup>+</sup>;

C<sub>16</sub>H<sub>18</sub>N<sub>4</sub>O · 0.44 H<sub>2</sub>O の分析計算値 : C, 66.20; H, 6.56; N, 19.30。実測値 : C, 66.23; H, 6.52; N, 19.35。

【0192】

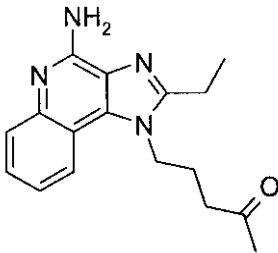
実施例 12、13、14 は、実施例 11 について上述した一般方法によって、適切なケタルの酸触媒加水分解によって調製した。

【0193】

50

## 実施例 1 2

5 - ( 4 - アミノ - 2 - エチル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オン  
【化 4 8】



10

2 - エチル - 1 - [ 3 - ( 2 - メチル - [ 1 , 3 ] ジオキソラン - 2 - イル ) プロピル ] - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミンを融点 2 0 6 ~ 2 0 8 の 5 - ( 4 - アミノ - 2 - エチル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オンに加水分解した。

MS ( A P C I )  $m/z = 297 (M + H)^+$  ;

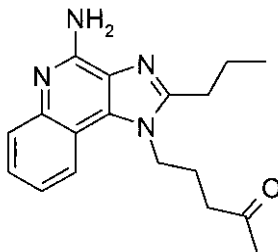
$C_{17}H_{20}N_4O$  の分析計算値 : C , 6 8 . 9 0 ; H , 6 . 8 0 ; N , 1 8 . 9 。 実測値 : C , 6 8 . 6 6 ; H , 6 . 8 4 ; N , 1 8 . 6 2 。

20

【 0 1 9 4 】

## 実施例 1 3

5 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オン  
【化 4 9】



30

1 - [ 3 - ( 2 - メチル - [ 1 , 3 ] ジオキソラン - 2 - イル ) プロピル ] - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミンを融点 1 7 6 ~ 1 7 7 の 5 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オンに加水分解した。

40

MS ( A P C I )  $m/z = 311 (M + H)^+$  ;

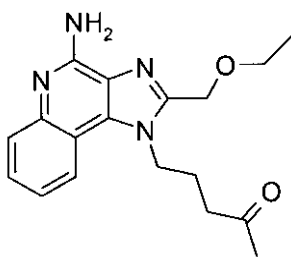
$C_{18}H_{22}N_4O \cdot 0.0125CH_2Cl_2$  の分析計算値 : C , 6 9 . 4 6 ; H , 7 . 1 3 ; N , 1 7 . 9 9 。 実測値 : C , 6 9 . 1 2 ; H , 7 . 1 5 ; N , 1 7 . 7 1 。

【 0 1 9 5 】

## 実施例 1 4

5 - ( 4 - アミノ - 2 - エトキシメチル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オン

## 【化50】



10

2 - エトキシメチル - 1 - [ 3 - ( 2 - メチル - [ 1 , 3 ] ジオキソラン - 2 - イル ) プロピル ] - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミンを融点 173 ~ 175 の 5 - ( 4 - アミノ - 2 - エトキシメチル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オンに加水分解した。

MS (APCI)  $m/z$  327 (M+H)<sup>+</sup>;

C<sub>18</sub>H<sub>22</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>の分析計算値：C, 66.24; H, 6.79; N, 17.17。実測値：C, 66.05; H, 6.94; N, 16.89。

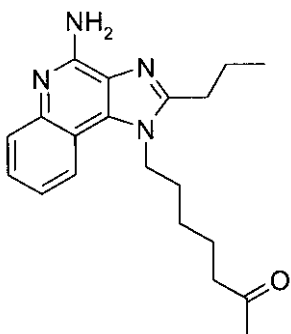
## 【0196】

## 実施例15

20

7 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ヘプタン - 2 - オン

## 【化51】



30

## ステップ1:

C. テンプル ( Temple ), Jr.、R. D. エリオット ( Elliott )、および J. A. モンゴメリー ( Montgomery )、J. Med. Chem.、1988年、31、697~700頁の一般方法によって、6 - アミノカプロン酸、塩化チオニル、およびエタノールからエチル 6 - アミノカプロン酸塩酸塩を調製した。実施例1のステップ1で述べられる一般方法を使用して、ジクロロメタン中で 4 - クロロ - 3 - ニトロキノリン ( 41.7 g、200 mmol )、エチル 6 - アミノカプロン酸塩酸塩 ( 46.9 g、240 mmol ) およびトリエチルアミン ( 50.6 g、500 mmol ) を 15 時間反応させて、エチル 6 - ( 3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ ) ヘキサノエート ( 60.6 g ) を黄色固形物として得た。

40

## 【0197】

## ステップ2:

パール水素付加容器にエチル 6 - ( 3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ ) ヘキサノエート ( 14.4 g、43.2 mmol )、炭素上の 10% パラジウム触媒 ( 1.0 g )、およびエタノール ( 250 mL ) を装填し、パール振盪機に載せてシステムを 40 psi

50

( $2.7 \times 10^5$  Pa) 水素に加圧した。15時間の振盪後、反応混合物をCELITE濾材を通して濾過し、減圧下で濃縮してエチル6-(3-アミノキノリン-4-イルアミノ)ヘキサノエートを暗色油(9.8g)として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。このステップを数回反復して、引き続くステップのための物質を得た。

【0198】

ステップ3:

トルエン(250mL)中のエチル6-(3-アミノキノリン-4-イルアミノ)ヘキサノエート(34.3g、114mmol)、オルト酪酸トリメチル(19.5g、131mmol)、およびピリジニウムp-トルエンスルホネート(1.0g、4.0mmol)の溶液をディーンスタークトラップ下で加熱して5時間還流し、周期的に留出物を排出して反応混合物に新鮮なトルエンを添加した。溶液を減圧下で濃縮し、残留物をジクロロメタン(150mL)に取り込んで、飽和水性重炭酸ナトリウム溶液および水(各100mL)で連続的に洗浄し、炭酸カリウム上で乾燥させ、濾過して減圧下で濃縮して、エチル6-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ヘキサノエート(36.0g)を暗色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

【0199】

ステップ4:

エタノール(100mL)中のエチル6-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ヘキサノエート(39.0g、110mmol)の溶液に、水(100mL)中の水酸化ナトリウム(5.73g、143mmol)の溶液を添加した。室温で一晩攪拌した後、揮発性物質を減圧下で除去し、残留物を水(200mL)に取り込んで、溶液をジクロロメタン(3×75mL)で洗浄し、次に約pH6に酸性化した。水性混合物をジクロロメタン(3×75mL)で抽出し、次に有機画分を合わせて、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濾過して減圧下で濃縮し、6-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ヘキサノ酸(31.0g)を固形物として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

【0200】

ステップ5:

氷浴内のジクロロメタン(200mL)中の6-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ヘキサノ酸(31.0g、95.3mmol)の溶液に、塩化オキサリル(21.9g、172mmol)を滴下して30分間かけて添加した。次に反応混合物を室温で1時間攪拌して、次に減圧下で濃縮し、ジクロロメタン(400mL)およびN,O-ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩(18.6g、190mmol)を残留物に添加し、続いてトリエチルアミン(38.5g、380mmol)を滴下して添加した。室温で一晩攪拌した後、反応混合物を飽和水性重炭酸ナトリウム溶液および鹼水(各100mL)で連続的に洗浄し、炭酸カリウム上で乾燥させ、濾過して減圧下で濃縮し、N-メトキシ-N-メチル-6-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ヘキサノアミド(28.0g)を暗色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

【0201】

ステップ6:

氷浴内のクロロホルム(20mL)およびTHF(200mL)中のN-メトキシ-N-メチル-6-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ヘキサノアミド(22.0g、59.7mmol)の溶液に、臭化メチルマグネシウム(40mLのジエチルエーテル中の3M溶液、120mmol)の溶液を滴下して添加した。1時間後、臭化メチルマグネシウム(40mLのジエチルエーテル中の3M溶液、120mmol)のさらに別の装填を添加し、反応混合物を室温でさらに1時間攪拌し、次に塩酸の10%溶液(約10mL)の添加によってクエンチした。混合物を減圧下で濃縮し、

10

20

30

40

50

残留物をジクロロメタン (200 mL) に取り込んで、溶液を飽和水性重炭酸ナトリウム溶液および鹹水 (各 100 mL) で連続的に洗浄し、炭酸カリウム上で乾燥させて濾過した。溶液を減圧下で濃縮し、シリカゲル上でクロマトグラフにかけ (ジクロロメタン中の 3% メタノールでの溶出)、7 - (2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリン - 1 - イル) ヘプタン - 2 - オン (12.6 g) を油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

【0202】

ステップ 7 :

実施例 1 のステップ 9 および 10 で述べられる一般方法を使用して、m - CPBA (8.0 g) との反応によって、7 - (2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリン - 1 - イル) ヘプタン - 2 - オン (5.0 g、15.5 mmol) をアミノ化し、7 - (5 - オキシド - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリン - 1 - イル) ヘプタン - 2 - オンを得て、続いて塩化 p - トルエンシルホニル (4.42 g、23.2 mmol) および水酸化アンモニウム溶液 (50 mL) との反応によって、アセトニトリル、酢酸エチル、およびヘキサン混合物からの再結晶化後に、7 - (4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリン - 1 - イル) ヘプタン - 2 - オン) を融点 161 ~ 163 の灰白色の固形物として得た。

MS (APCI) m/z = 339 (M + H)<sup>+</sup> ;

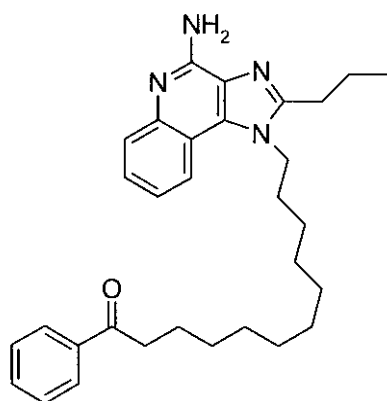
C<sub>20</sub>H<sub>26</sub>N<sub>4</sub>O の分析計算値 : C, 70.98 ; H, 7.74 ; N, 16.55。実測値 : C, 70.62 ; H, 7.91 ; N, 16.37。

【0203】

実施例 16

12 - (4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [4, 5 - c] キノリン - 1 - イル) - 1 - フェニルドデカン - 1 - オン塩酸塩

【化 5 2】



ステップ 1 :

C. テンプル (Temple), Jr., R. D. エリオット (Elliott), および J. A. モンゴメリー (Montgomery), J. Med. Chem., 1988 年、31、697 ~ 700 頁の一般方法によって、12 - アミノドデカン酸、塩化チオニル、およびエタノールからエチル 12 - アミノドデカノエート塩酸塩を調製した。実施例 15 のステップ 1 で述べられる一般方法を使用して、ジクロロメタン中で 4 - クロロ - 3 - ニトロキノリン (15.5 g、74.4 mmol)、エチル 12 - アミノドデカノエート塩酸塩 (25.0 g、89.3 mmol) とトリエチルアミン (18.8 g、186 mmol) とを 15 時間反応させて、エチル 12 - (3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ) ドデカノエート (30.0 g) を黄色固形物として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

## 【0204】

## ステップ2:

実施例15のステップ2で述べられる一般方法を使用して、エチル12-(3-ニトロキノリン-4-イルアミノ)ドデカノエート(30.0g、77.0mmol)を還元して、エチル12-(3-アミノキノリン-4-イルアミノ)ドデカノエート(30.4g)を固形物として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

## 【0205】

## ステップ3:

実施例15のステップ3で述べられる一般方法を使用して、オルト酪酸トリメチル(13.4g、90.6mmol)との反応によって、エチル12-(3-アミノキノリン-4-イルアミノ)ドデカノエート(30.4g、78.8mmol)を環化して、エチル12-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ドデカノエート(32.1g)を固形物として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

10

## 【0206】

## ステップ4および5:

実施例15のステップ4で述べられる一般方法を使用して、12-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ドデカン酸(33.6g)を得て、実施例15のステップ5で述べられる一般方法によって、それをN-メトキシ-N-メチル-12-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ドデカン

20

## 【0207】

## ステップ6:

実施例15のステップ6で述べられる一般方法を使用して、N-メトキシ-N-メチル-12-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ドデカンアミド(6.0g、13.3mmol)とフェニル臭化マグネシウム(26.5mmol、26.5mLのTHF中の1M溶液)とを反応させて、1-フェニル-12-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ドデカン-1-オン(6.0g)を得た。

30

## 【0208】

## ステップ7:

実施例1のステップ9および10で述べられる一般方法を使用して、m-CPBA(8.18g)との反応によって1-フェニル-12-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ドデカン-1-オン(6.0g、12.8mmol)をアミノ化して、塩化p-トルエンスルホニル(3.65g、19.2mmol)および水酸化アンモニウム溶液(40mL)との反応に続いて、12-(5-オキシド-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)-1-フェニルドデカン-1-オンを得た。生成物をエタノールおよびジエチルエーテルの混合物に溶解し、塩化水素溶液(ジエチルエーテル中の1.0M溶液の1当量)を添加した。沈殿物が形成し、溶剤を減圧下で除去した。得られた固形物をイソプロパノールおよびヘキサンの混合物から再結晶化し、12-(4-アミノ-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)-1-フェニルドデカン-1-オン塩酸塩を融点195~196の灰白色の固形物として得た。

40

MS (APCI) m/z = 485 (M+H)<sup>+</sup>;

C<sub>31</sub>H<sub>40</sub>N<sub>4</sub>O · 1.20HCl · 0.17H<sub>2</sub>Oの分析計算値: C, 70.05; H, 7.87; N, 10.52。実測値: C, 69.97; H, 7.70; N, 10.46。

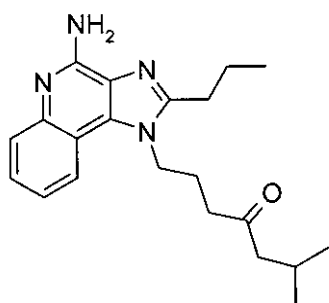
## 【0209】

## 実施例17

1-(4-アミノ-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)-6-メチルヘプタン-4-オン

50

## 【化 5 3】



10

## ステップ 1 :

実施例 1 のステップ 15 で述べられる一般方法を使用して、ジクロロメタン中で 4 - クロロ - 3 - ニトロキノリン ( 49 . 6 g、238 mmol )、エチル 4 - アミノブチレート塩酸塩 ( 43 . 8 g、262 mmol )、およびトリエチルアミン ( 36 . 1 g、357 mmol ) を 15 時間反応させて、エチル 4 - ( 3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ ) ブチレート ( 63 . 8 g ) を黄色固形物として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

20

## 【 0 2 1 0 】

## ステップ 2 :

実施例 6 のステップ 2 で述べられる一般方法を使用して、エチル 4 - ( 3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ ) ブチレート ( 37 . 0 g、122 mmol ) を還元して、エチル 4 - ( 3 - アミノキノリン - 4 - イルアミノ ) ブチレート ( 24 . 9 g ) を暗色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

## 【 0 2 1 1 】

## ステップ 3 :

実施例 15 のステップ 3 で述べられる一般方法を使用して、オルト酪酸トリメチル ( 10 . 4 g、70 . 2 mmol ) との反応によってエチル 4 - ( 3 - アミノキノリン - 4 - イルアミノ ) ブチレート ( 18 . 0 g、65 . 9 mmol ) を環化して、エチルシリカゲル上でのクロマトグラフィー後に ( ジクロロメタン中の 5 % メタノールでの溶出 ) エチル 4 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ブチレート ( 14 . 2 g ) を固形物として得た。

30

## 【 0 2 1 2 】

## ステップ 4 :

0 で、ジクロロメタン ( 150 mL ) 中の N , O - ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩 ( 15 . 6 g、160 mmol ) の攪拌される懸濁液に、トルエン ( 80 mL の 2 M 溶液、160 mmol ) 中のトリメチルアルミニウムの溶液を滴下して添加した。15 分後、反応フラスコを氷浴から取り出して、溶液を室温で 15 分間攪拌した。次にフラスコを氷浴内で冷却し、ジクロロメタン ( 100 mL ) 中のエチル 4 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ブチレート ( 34 . 7 g、107 mmol ) の溶液を迅速に滴下して添加した。15 分後、氷浴を除去し、溶液を加熱して還流し、かなりのガス発生を引き起こした。20 時間後、水 ( 15 mL ) 中の塩酸の 10 % 溶液、続いて水 ( 50 mL ) 中の重炭酸ナトリウム飽和溶液を緩慢に添加した。層が分離し、ジクロロメタン ( 2 x 50 mL ) で水性混合物を抽出した。合わせた有機溶液を水 ( 2 x 50 mL ) 中の水酸化ナトリウムの 5 % 溶液、および水 ( 1 x 50 mL ) 中の重炭酸ナトリウムの飽和溶液で連続的に洗浄し、炭酸カリウム上で乾燥させ、濾過して減圧下で濃縮し、N - メトキシ - N - メチル - 4 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ブチルアミド ( 35 . 9 g ) を暗色油として得て、それをさらに精製す

40

50

ることなく次のステップで直接使用した。

【0213】

ステップ5:

ドライアイス/イソプロパノール浴内のTHF(100mL)中のN-メトキシ-N-メチル-4-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ブチルアミド(4.80g、14.1mmol)の攪拌される溶液に、イソブチルマグネシウム塩化物(28mLのジエチルエーテル中の2M溶液、56mmol)の溶液を数分間かけて添加した。添加完了時に、反応フラスコを冷浴から除去し、混合物を室温で4時間攪拌した。水(3mL)中の塩酸の10%溶液、続いて水(15mL)中の重炭酸ナトリウム飽和溶液、およびジクロロメタン(100mL)を緩慢に添加した。層が分離し、水性相をジクロロメタン(1×75mL)で抽出し、有機物を合わせて炭酸カリウム上で乾燥させ、濾過して減圧下で濃縮した。シリカゲル上でのクロマトグラフィー(ジクロロメタン中の5%メタノールでの溶出)後に、6-メチル-1-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ヘプタン-4-オン(2.40g)を油として得た。

10

【0214】

ステップ6:

実施例1のステップ9および10で述べられる一般方法を使用して、m-CPBA(3.9g)との反応によって6-メチル-1-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ヘプタン-4-オン(2.40g、7.10mmol)をアミノ化し、6-メチル-1-(5-オキシド-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ヘプタン-4-オンを得て、続いて塩化p-トルエンスルホン(2.0g、10.5mmol)および水酸化アンモニウム溶液(75mL)との反応によって、水性メタノールからの再結晶化後に1-(4-アミノ-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)-6-メチルヘプタン-4-オンを融点136~138の黄褐色結晶として得た。

20

MS(APCI)m/z353(M+H)<sup>+</sup>;

C<sub>21</sub>H<sub>28</sub>N<sub>4</sub>Oの分析計算値:C,71.56;H,8.01;N,15.90。実測値:C,71.33;H,8.09;N,15.69。

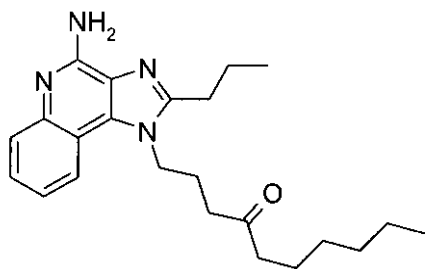
【0215】

30

実施例18

1-(4-アミノ-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)デカン-4-オン

【化54】



40

ステップ1~4:

実施例17のステップ1~4で述べられる一般方法を使用して、N-メトキシ-N-メチル-4-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ブチルアミドを調製した。

【0216】

ステップ5:

50

実施例 17 のステップ 5 で述べられる一般方法を使用して、N - メトキシ - N - メチル - 4 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) プチルアミド ( 6 . 1 0 g 、 1 7 . 9 m m o l ) と n - ヘキシル臭化マグネシウム ( 1 3 . 5 m L のジエチルエーテル中の 2 M 溶液、 2 7 m m o l ) とを反応させて、1 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) デカン - 4 - オン ( 6 . 1 0 g ) を黄色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

【 0 2 1 7 】

ステップ 6 :

実施例 1 のステップ 9 および 1 0 で述べられる一般方法を使用して、m - C P B A ( 8 . 5 0 g ) との反応によって 1 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) デカン - 4 - オン ( 6 . 1 0 g 、 1 7 . 2 m m o l ) をアミノ化し、1 - ( 5 - オキシド - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) デカン - 4 - オンを得て、続いて塩化 p - トルエンシルホニル ( 4 . 9 0 g 、 2 5 . 8 m m o l ) および水酸化アンモニウム溶液 ( 1 0 0 m L ) との反応によって、水性メタノールからの再結晶化後に 1 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) デカン - 4 - オン ) を融点 1 1 1 ~ 1 1 3 の白色固形物として得た。

M S ( A P C I ) m / z 3 8 1 ( M + H ) <sup>+</sup> ;

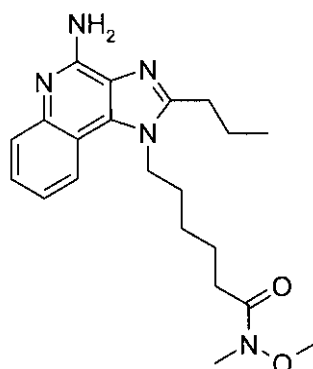
C<sub>23</sub>H<sub>32</sub>N<sub>4</sub>O の分析計算値 : C , 7 2 . 5 9 ; H , 8 . 4 8 ; N , 1 4 . 7 2 。 実測値 : C , 7 2 . 5 3 ; H , 8 . 5 9 ; N , 1 4 . 6 3 。

【 0 2 1 8 】

実施例 1 9

6 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - N - メトキシ - N - メチルヘキサンアミド

【 化 5 5 】



ステップ 1 ~ 5 :

実施例 1 5 のステップ 1 ~ 5 で述べられる方法を使用して、N - メトキシ - N - メチル - 6 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ヘキサンアミドを調製した。

【 0 2 1 9 】

ステップ 6 :

実施例 1 のステップ 9 および 1 0 で述べられる一般方法を使用して、m - C P B A ( 6 . 1 3 g ) との反応によって N - メトキシ - N - メチル - 6 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ヘキサンアミド ( 4 . 0 1 g 、 1 0 . 9 m m o l ) をアミノ化して、N - メトキシ - N - メチル - 6 - ( 5 - オキシド - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ヘキサンアミドを得て、続いて酢

酸エチルおよびヘキサン混合物からの再結晶化後に、塩化 p - トルエンスルホニル ( 2 . 53 g、13 . 3 mmol ) および水酸化アンモニウム溶液 ( 40 mL ) との反応によって 6 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - N - メトキシ - N - メチルヘキサナムド) を融点 134 ~ 135 の灰白色の固形物として得た。

MS ( APCI ) m / z = 384 ( M + H )<sup>+</sup> ;

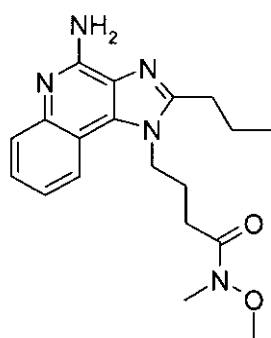
C<sub>21</sub>H<sub>29</sub>N<sub>5</sub>O<sub>2</sub> · 0 . 023 C<sub>4</sub>H<sub>8</sub>O<sub>2</sub> の分析計算値 : C , 65 . 71 ; H , 7 . 63 ; N , 18 . 17 。 実測値 : C , 65 . 44 ; H , 7 . 77 ; N , 17 . 88 。

【 0220 】

実施例 20

4 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - N - メトキシ - N - メチルブチルアミド

【 化 56 】



ステップ 1 ~ 4 :

実施例 17 のステップ 1 ~ 4 の方法を使用して、N - メトキシ - N - メチル - 4 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ブチルアミドを調製した。

【 0221 】

ステップ 5 :

実施例 1 のステップ 9 および 10 で述べられる一般方法を使用して、m - CPBA ( 9 . 50 g ) との反応によって N - メトキシ - N - メチル - 4 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ブチルアミド ( 7 . 4 g、21 . 7 mmol ) をアミノ化して、N - メトキシ - N - メチル - 4 - ( 5 - オキシド - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ブチルアミドを得て、続いて塩化 p - トルエンスルホニル ( 7 . 20 g、37 . 8 mmol ) および水酸化アンモニウム溶液 ( 200 mL ) との反応によって、水性メタノールからの再結晶化後に 4 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - N - メトキシ - N - メチル - ブチルアミドを融点 163 ~ 165 の白色結晶として得た。

MS ( APCI ) m / z 356 ( M + H )<sup>+</sup> ;

C<sub>19</sub>H<sub>25</sub>N<sub>5</sub>O<sub>2</sub> の分析計算値 : C , 64 . 20 ; H , 7 . 09 ; N , 19 . 70 。 実測値 : C , 64 . 10 ; H , 6 . 91 ; N , 19 . 57 。

【 0222 】

実施例 21

12 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - N - メトキシ - N - メチルドデカンアミド塩酸塩

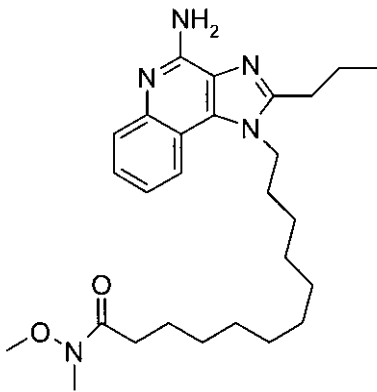
10

20

30

40

## 【化 5 7】



10

ステップ 1 ~ 5 :

実施例 16 のステップ 1 ~ 5 の方法を使用して、N - メトキシ - N - メチル - 12 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ドデカンアミドを調製した。

## 【 0 2 2 3 】

20

ステップ 6 :

実施例 1 のステップ 9 および 10、および実施例 16 のステップ 7 で述べられる一般方法を使用して、m - CPBA ( 6 . 13 g ) との反応によって N - メトキシ - N - メチル - 12 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ドデカンアミド ( 4 . 01 g、8 . 86 mmol ) をアミノ化して、N - メトキシ - N - メチル - 12 - ( 5 - オキシド - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ドデカンアミドを得て、続いて塩化 p - トルエンスルホニル ( 2 . 53 g、13 . 3 mmol ) および水酸化アンモニウム溶液 ( 40 mL ) との反応によって、イソプロパノールからの塩酸塩の再結晶後に、2 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - N - メトキシ - N - メチルドデカンアミド塩酸塩を融点 156 ~ 158 の灰白色の固形物として得た。

30

MS ( APCI ) m / z = 468 ( M + H )<sup>+</sup> ;

C<sub>27</sub>H<sub>41</sub>N<sub>5</sub>O<sub>2</sub> · 1 . 20 HCl の分析計算値 : C , 63 . 41 ; H , 8 . 31 ; N , 13 . 69。実測値 : C , 63 . 44 ; H , 8 . 24 ; N , 13 . 74。

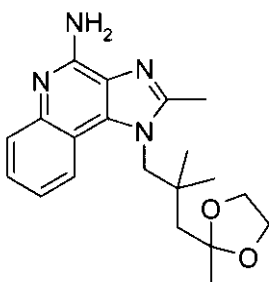
## 【 0 2 2 4 】

実施例 2 2

1 - [ 2 , 2 - ジメチル - 3 - ( 2 - メチル - [ 1 , 3 ] ジオキサラン - 2 - イル ) プロピル ] - 2 - メチル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミン

## 【化 5 8】

40



50

## ステップ 1 :

ニトロメタン (36.3 g、0.59 mol)、メシチルオキシド (53.0 g、0.54 mol)、および 1,5 - ジアザピシクロ [5.4.0] ウンデク 7 - エン (DBU、1.5 g、10 mmol) の混合物を室温に 14 日間放置した。次にジクロロメタン (150 mL) を添加し、溶液を 10% 塩酸溶液 (3 × 35 mL) で洗浄し、炭酸カリウム上で乾燥させて濾過した。4,4 - ジメチル - 5 - ニトロペンタン - 2 - オンのジクロロメタン溶液を次のステップでさらに精製することなく直接使用した。

【0225】

## ステップ 2 :

ジクロロメタン (50 mL) 中の 1,2 - ビス (トリメチルシリルオキシ) エタン (26.5 g、128 mmol) の攪拌される溶液をドライアイス / イソプロパノール浴内で冷却し、トリメチルシリルトリフルオロメタンスルホネート (2.2 g、1.0 mmol)、続いて先のステップからの 4,4 - ジメチル - 5 - ニトロペンタン - 2 - オン (50 mL、19.0 g、119 mmol) のジクロロメタン溶液を添加した。30 分後冷浴を除去し、溶液が室温に暖まるまで放置した。炭酸カリウムのプラグを通して溶液を濾過し、減圧下で濃縮して 2 - (2,2 - ジメチル - 3 - ニトロプロピル) - 2 - メチル - [1,3] ジオキソラン (23.5 g) を暗色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

10

【0226】

## ステップ 3 :

パール水素付加容器に 2 - (2,2 - ジメチル - 3 - ニトロプロピル) - 2 - メチル - [1,3] ジオキソラン (23.1 g、113 mmol)、炭素上の 5% 白金触媒 (3.0 g) およびエタノール (250 mL) を装填し、パール振盪機に載せてシステムを 50 psi (3.4 × 10<sup>5</sup> Pa) 水素に加圧した。24 時間振盪した後、CELLITE 濾材を通して反応混合物を濾過し、減圧下で濃縮して、2,2 - ジメチル - 3 - (2 - メチル - [1,3] ジオキソラン - 2 - イル) プロピルアミン (19.8 g) を油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

20

【0227】

## ステップ 4 :

実施例 1 のステップ 1 で述べられる一般方法を使用して、ジクロロメタン中で 4 - クロロ - 3 - ニトロキノリン (21.8 g、104 mmol)、2,2 - ジメチル - 3 - (2 - メチル - [1,3] ジオキソラン - 2 - イル) プロピルアミン (19.8 g、114 mmol) およびトリエチルアミン (15.2 g、150 mmol) を 75 時間反応させて、[2,2 - ジメチル - 3 - (2 - メチル - [1,3] ジオキソラン - 2 - イル) プロピル] - (3 - ニトロキノリン - 4 - イル) アミン (35.9 g) を黄色固形物として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

30

【0228】

## ステップ 5 :

実施例 6 のステップ 2 で述べられる一般方法を使用して、[2,2 - ジメチル - 3 - (2 - メチル - [1,3] ジオキソラン - 2 - イル) プロピル] - (3 - ニトロキノリン - 4 - イル) アミン (35.9 g、104 mmol) を還元して、N<sup>4</sup> - [2,2 - ジメチル - 3 - (2 - メチル - [1,3] ジオキソラン - 2 - イル) プロピル] キノリン - 3,4 - ジアミン (25.2 g) を暗色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

40

【0229】

## ステップ 6 :

実施例 6 のステップ 3 で述べられる一般方法を使用して、トリメチルオルト酢酸 (3.6 g、30 mmol) との反応によって、N<sup>4</sup> - [2,2 - ジメチル - 3 - (2 - メチル - [1,3] ジオキソラン - 2 - イル) プロピル] キノリン - 3,4 - ジアミン (8.0 g、25.4 mmol) を環化して、シリカゲル上でのクロマトグラフィー (溶出液 1 L あた

50

り約 5 mL の水酸化アンモニウム溶液を含有する、ジクロロメタン中の 7%メタノール溶液での溶出)後に、1-[2,2-ジメチル-3-(2-メチル-[1,3]ジオキサラン-2-イル)プロピル]-2-メチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン(5.80 g)を固形物として得た。

【0230】

ステップ7:

実施例1のステップ9および10で述べられる一般方法を使用して、m-CPBA(7.5 g)との反応によって1-[2,2-ジメチル-3-(2-メチル-[1,3]ジオキサラン-2-イル)プロピル]-2-メチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン(5.80 g、17.1 mmol)をアミノ化し、1-[2,2-ジメチル-3-(2-メチル-[1,3]ジオキサラン-2-イル)プロピル]-2-メチル-5-オキシド-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリンを得て、続いて塩化p-トルエンスルホニル(5.7 g、30 mmol)および水酸化アンモニウム溶液(150 mL)との反応によって、アセトニトリル、メタノール、および水混合物からの再結晶化後に、1-[2,2-ジメチル-3-(2-メチル-[1,3]ジオキサラン-2-イル)プロピル]-2-メチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミンを融点209~211の淡褐色固形物として得た。

MS (APCI) m/z 355 (M+H)<sup>+</sup>;

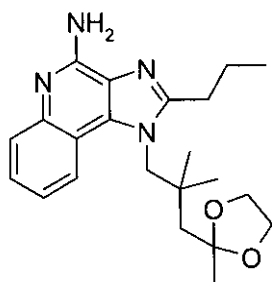
C<sub>20</sub>H<sub>26</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>の分析計算値:C, 67.77; H, 7.39; N, 15.81。実測値:C, 67.68; H, 7.62; N, 15.87。

【0231】

実施例23

1-[2,2-ジメチル-3-(2-メチル-[1,3]ジオキサラン-2-イル)プロピル]-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミン

【化59】



ステップ1~5は、実施例22について述べられるのと同ーである。

【0232】

ステップ6:

実施例22のステップ6で述べられる一般方法を使用して、オルト酪酸トリメチル(4.4 g、30 mmol)との反応によってN<sup>4</sup>-[2,2-ジメチル-3-(2-メチル-[1,3]ジオキサラン-2-イル)プロピル]キノリン-3,4-ジアミン(9.1 g、28.9 mmol)を環化して、シリカゲル上でのクロマトグラフィー(溶出液1 Lあたり約5 mLの水酸化アンモニウム溶液を含有する、ジクロロメタン中の7%メタノール溶液での溶出)後に、1-[2,2-ジメチル-3-(2-メチル-[1,3]ジオキサラン-2-イル)プロピル]-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン(3.10 g)を固形物として得た。

【0233】

ステップ7:

実施例1のステップ9および10で述べられる一般方法を使用して、m-CPBA(3

・70g)との反応によって1-[2,2-ジメチル-3-(2-メチル-[1,3]ジオキサラン-2-イル)プロピル]-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン(3.10g、8.44mmol)をアミノ化して、1-[2,2-ジメチル-3-(2-メチル-[1,3]ジオキサラン-2-イル)プロピル]-5-オキシド-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリンを得て、続いて塩化p-トルエンスルホン(2.80g、14.7mmol)および水酸化アンモニウム溶液(100mL)との反応によって、水性メタノールからの再結晶化後に1-[2,2-ジメチル-3-(2-メチル-[1,3]ジオキサラン-2-イル)プロピル]-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミンを融点186~188の灰白色の針状晶として得た。

10

MS (APCI) m/z 383 (M+H)<sup>+</sup>;

C<sub>22</sub>H<sub>30</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>の分析計算値：C, 69.08; H, 7.91; N, 14.65。実測値：C, 69.03; H, 8.15; N, 14.60。

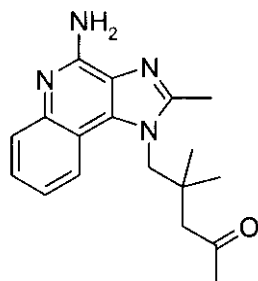
【0234】

実施例24

5-(4-アミノ-2-メチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)-4,4-ジメチルペンタン-2-オン

【化60】

20



実施例11の一般方法によって、1-[2,2-ジメチル-3-(2-メチル-[1,3]ジオキサラン-2-イル)プロピル]-2-メチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミンを水性塩酸で加水分解して、水性アセトニトリルからの再結晶化後に5-(4-アミノ-2-メチル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)-4,4-ジメチルペンタン-2-オンを融点223~225の淡褐色固形物として得た。

30

MS (APCI) m/z 311 (M+H)<sup>+</sup>;

C<sub>18</sub>H<sub>22</sub>N<sub>4</sub>Oの分析計算値：C, 69.65; H, 7.14; N, 18.05。実測値：C, 69.64; H, 7.42; N, 18.04。

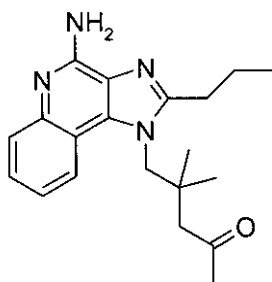
【0235】

実施例25

5-(4-アミノ-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)-4,4-ジメチルペンタン-2-オン

40

## 【化 6 1】



10

実施例 11 の一般方法によって、1 - [ 2 , 2 - ジメチル - 3 - ( 2 - メチル - [ 1 , 3 ] ジオキソラン - 2 - イル ) プロピル ] - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミンを水性塩酸で加水分解し、水性アセトニトリルからの再結晶化後に 5 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - 4 , 4 - ジメチルペンタン - 2 - オンを融点 178 ~ 180 の淡褐色固形物として得た。

MS ( APCI )  $m/z$  339 (  $M + H$  )<sup>+</sup> ;

$C_{20}H_{26}N_4O$  の分析計算値 : C , 70 . 97 ; H , 7 . 74 ; N , 16 . 55 。 実測値 : C , 70 . 80 ; H , 7 . 89 ; N , 16 . 66 。

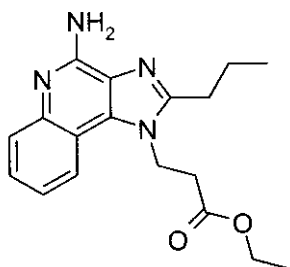
20

## 【 0 2 3 6 】

## 実施例 26

エチル 3 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) プロピオネート

## 【化 6 2】



30

## ステップ 1 :

実施例 1 のステップ 1 で述べられる一般方法を使用して、ジクロロメタン中で 4 - クロロ - 3 - ニトロキノリン ( 45 . 3 g 、 217 mmol )、 - アラニンエチルエステル塩酸塩 ( 40 . 0 g 、 240 mmol )、およびトリエチルアミン ( 54 . 8 g 、 542 mmol ) を 15 時間反応させ、エチル 3 - ( 3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ ) プロピオネート ( 62 . 0 g ) を黄色固形物として得た。

40

## 【 0 2 3 7 】

## ステップ 2 :

実施例 6 のステップ 2 で述べられる一般方法を使用して、エチル 3 - ( 3 - ニトロキノリン - 4 - イルアミノ ) プロピオネートを還元し、エチル 3 - ( 3 - アミノキノリン - 4 - イルアミノ ) プロピオネート ( 40 . 2 g ) を暗色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

50

## 【0238】

## ステップ3:

実施例15のステップ3で述べられる一般方法を使用して、オルト酪酸トリメチル(7.22g、48.7mmol)との反応によってエチル3-(3-アミノキノリン-4-イルアミノ)プロピオネート(11.0g、42.4mmol)を環化してエチル3-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)プロピオネート(10.6g)を暗色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

## 【0239】

## ステップ4:

実施例1のステップ9および10で述べられる一般方法を使用して、m-CPBA(4.63g)との反応によってエチル3-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)プロピオネート(3.30g、10.6mmol)をアミノ化して、エチル3-(5-オキシド-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)プロピオネートを得て、続いて塩化p-トルエンスルホン(3.53g、18.6mmol)および水酸化アンモニウム溶液(50mL)との反応によって、水性メタノールからの再結晶化後にエチル3-(4-アミノ-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)プロピオネートを融点156~157の灰白色の固形物として得た。

MS (APCI) m/z = 327 (M+H)<sup>+</sup>;

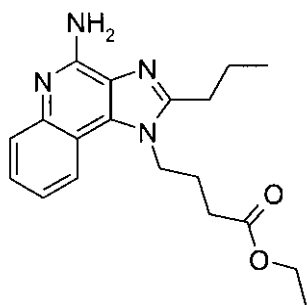
C<sub>18</sub>H<sub>22</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>の分析計算値: C, 66.24; H, 6.79; N, 17.16。実測値: C, 65.98; H, 6.96; N, 17.29。

## 【0240】

## 実施例27

エチル4-(4-アミノ-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ブチレート

## 【化63】



実施例1のステップ9および10で述べられる一般方法を使用して、m-CPBA(14.1g)との反応によってエチル4-(2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ブチレート(8.20g、25.2mmol、実施例17のステップ3から入手できる)をアミノ化し、エチル4-(5-オキシド-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ブチレートを得て、続いて塩化p-トルエンスルホン(8.40g、44.1mmol)および水酸化アンモニウム溶液(150mL)との反応によって、水性メタノールからの再結晶化後にエチル4-(4-アミノ-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル)ブチレートを融点154~156の灰白色の固形物として得た。

MS (APCI) m/z = 341 (M+H)<sup>+</sup>;

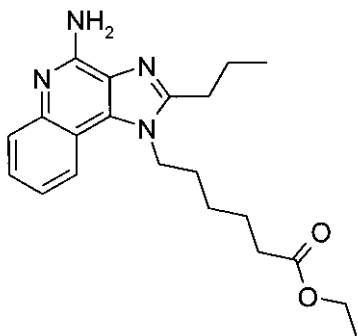
C<sub>19</sub>H<sub>24</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>の分析計算値: C, 67.04; H, 7.11; N, 16.46。実測値: C, 66.68; H, 6.87; N, 16.51。

## 【0241】

## 実施例 28

エチル 6 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ヘキサノエート

## 【化 6 4】



10

実施例 1 のステップ 9 および 10 で述べられる一般方法を使用して、m - CPBA ( 13 . 1 g ) との反応によってエチル 6 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ヘキサノエート ( 6 . 30 g、17 . 8 mmol、実施例 15 のステップ 3 から入手できる ) をアミノ化して、エチル 6 - ( 5 - オキシド - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ヘキサノエートを得て、続いて塩化 p - トルエンスルホニル ( 4 . 58 g、24 . 0 mmol ) および水酸化アンモニウム溶液 ( 60 mL ) との反応によって、水性メタノールからの再結晶化後にエチル 6 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ヘキサノエートを融点 112 ~ 113 の黄褐色固形物として得た。

20

MS ( APCI ) m / z = 369 ( M + H )<sup>+</sup> ;

C<sub>21</sub>H<sub>28</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub> · 1 . 0 H<sub>2</sub>O の分析計算値 : C , 67 . 77 ; H , 7 . 69 ; N , 15 . 05。実測値 : C , 67 . 39 ; H , 7 . 73 ; N , 14 . 79。

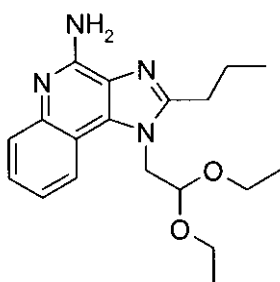
30

## 【0242】

## 実施例 29

1 - ( 2 , 2 - ジエトキシエチル ) - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 4 - アミン

## 【化 6 5】



40

## ステップ 1 :

実施例 1 のステップ 1 で述べられる一般方法を使用して、ジクロロメタン中で 4 - クロロ - 3 - ニトロキノリン ( 20 . 9 g、100 mmol )、アミノアセトアルデヒドジエチルアセタール ( 14 . 4 g、110 mmol )、およびトリエチルアミン ( 12 . 6 g

50

、125 mmol)を15時間反応させて、(2,2-ジエトキシエチル)-(3-ニトロキノリン-4-イル)アミン(29.7 g)を黄色固形物として得た。

【0243】

ステップ2:

実施例6のステップ2で述べられる一般方法を使用して、(2,2-ジエトキシエチル)-(3-ニトロキノリン-4-イル)アミンを還元し、N<sup>4</sup>-(2,2-ジエトキシエチル)キノリン-3,4-ジアミン(26.5 g)を暗色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

【0244】

ステップ3:

実施例15のステップ3で述べられる一般方法を使用して、オルト酪酸トリメチル(15.9 g、107 mmol)との反応によってN<sup>4</sup>-(2,2-ジエトキシエチル)キノリン-3,4-ジアミン(26.5 g、96.2 mmol)を環化して、1-(2,2-ジエトキシエチル)-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン(25.4 g)を暗色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

【0245】

ステップ4:

実施例1のステップ9および10で述べられる一般方法を使用して、m-CPBA(6.0 g)との反応によって1-(2,2-ジエトキシエチル)-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン(4.50 g、13.7 mmol)をアミノ化して、1-(2,2-ジエトキシエチル)-5-オキシド-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリンを得て、続いて塩化p-トルエンスルホン(4.60 g、24.1 mmol)および水酸化アンモニウム溶液(130 mL)との反応によって、水性メタノールからの再結晶化後に1-(2,2-ジエトキシエチル)-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミンを融点148~150の灰白色の固形物として得た。

MS (APCI) m/z = 343 (M+H)<sup>+</sup>;

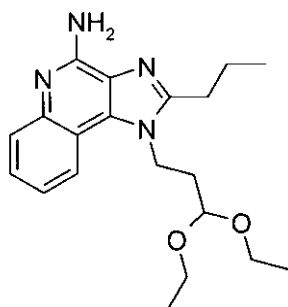
C<sub>19</sub>H<sub>26</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>の分析計算値: C, 66.64; H, 7.65; N, 16.36。実測値: C, 66.62; H, 7.80; N, 16.43

【0246】

実施例30

1-(3,3-ジエトキシプロピル)-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミン

【化66】



ステップ1:

実施例1のステップ1で述べられる一般方法を使用して、ジクロロメタン中で4-クロロ-3-ニトロキノリン(20.3 g、97.1 mmol)、1-アミノ-3,3-ジエトキシプロパン(25.0 g、116 mmol)およびトリエチルアミン(33.8 g、

333 mmol) を 15 時間反応させて、(3,3-ジエトキシプロピル)-(3-ニトロキノリン-4-イル)アミン(30.5 g) を黄色固形物として得た。

【0247】

ステップ 2 :

実施例 6 のステップ 2 で述べられる一般方法を使用して、(3,3-ジエトキシプロピル)-(3-ニトロキノリン-4-イル)アミンを還元して、N<sup>4</sup>-(3,3-ジエトキシプロピル)キノリン-3,4-ジアミン(20.7 g) を暗色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

【0248】

ステップ 3 :

実施例 15 のステップ 3 で述べられる一般方法を使用して、オルト酪酸トリメチル(13.2 g、89.4 mmol) との反応によって N<sup>4</sup>-(3,3-ジエトキシプロピル)キノリン-3,4-ジアミン(20.7 g、71.5 mmol) を環化して、1-(3,3-ジエトキシプロピル)-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン(22.3 g) を暗色油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

【0249】

ステップ 4 :

実施例 1 のステップ 9 および 10 で述べられる一般方法を使用して、m-CPBA(5.3 g) との反応によって 1-(3,3-ジエトキシプロピル)-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン(4.50 g、13.2 mmol) をアミノ化し、1-(3,3-ジエトキシプロピル)-5-オキシド-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリンを得て、続いて塩化 p-トルエンスルホン(4.89 g、25.7 mmol) および水酸化アンモニウム溶液(40 mL) との反応によって、メタノールからの再結晶化後に 1-(3,3-ジエトキシプロピル)-2-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミンを融点 148 ~ 150 の灰色針状晶として得た。

MS (APCI) m/z = 357 (M+H)<sup>+</sup>;

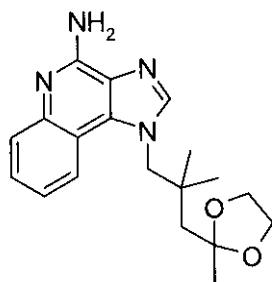
C<sub>20</sub>H<sub>28</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub> の分析計算値: C, 67.39; H, 7.92; N, 15.72。実測値: C, 67.24; H, 8.05; N, 15.70。

【0250】

実施例 31

1-[2,2-ジメチル-3-(2-メチル[1,3]ジオキサラン-2-イル)プロピル]-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-4-アミン

【化 67】



ステップ 1 ~ 5 は、実施例 22 について述べられるのと同ーである。

【0251】

ステップ 6 :

実施例 22 のステップ 6 で述べられる一般方法を使用して、トリメチルオルトギ酸(3.3 g、10 mmol) との反応によって N<sup>4</sup>-[2,2-ジメチル-3-(2-メチル-

[ 1, 3 ] ジオキソラン - 2 - イル) プロピル] キノリン - 3, 4 - ジアミン ( 8 . 1 g、  
25 . 7 mmol ) を環化して 1 - [ 2, 2 - ジメチル - 3 - ( 2 - メチル [ 1, 3 ] ジオ  
キソラン - 2 - イル) プロピル] - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン ( 8 . 8 g )  
を油として得て、それをさらに精製することなく次のステップで直接使用した。

【 0 2 5 2 】

ステップ 7 :

実施例 1 のステップ 9 および 10 で述べられる一般方法を使用して、m - CPBA ( 1  
1 . 8 g ) との反応によって 1 - [ 2, 2 - ジメチル - 3 - ( 2 - メチル [ 1, 3 ] ジオ  
キソラン - 2 - イル) プロピル] - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン ( 8 . 8 g、2  
7 mmol ) をアミノ化して、1 - [ 2, 2 - ジメチル - 3 - ( 2 - メチル - [ 1, 3 ] ジ  
オキソラン - 2 - イル) プロピル] - 5 - オキシド - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノ  
リンを得て、続いて塩化 p - トルエンスルホニル ( 9 . 1 g、48 mmol ) および水酸  
化アンモニウム溶液 ( 100 mL ) との反応によって、シリカゲル上でのクロマトグラフ  
ィー ( 溶出液 1 L あたり約 5 mL の水酸化アンモニウム溶液を含有する、ジクロロメタン  
中の 7 % メタノール溶液での溶出) および水性メタノールからの再結晶化後に、1 - [ 2  
, 2 - ジメチル - 3 - ( 2 - メチル [ 1, 3 ] ジオキソラン - 2 - イル) プロピル] - 1 H  
- イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 4 - アミンを融点 153 ~ 155 の淡褐色固形物  
として得た。

10

MS ( APCI ) m / z 341 ( M + H )<sup>+</sup> ;

C<sub>19</sub>H<sub>24</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub> の分析計算値 : C, 67 . 04 ; H, 7 . 11 ; N, 16 . 46。実測値  
: C, 66 . 76 ; H, 7 . 39 ; N, 16 . 41。

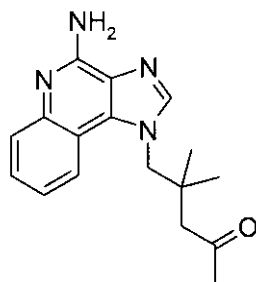
20

【 0 2 5 3 】

実施例 3 2

5 - ( 4 - アミノ - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - 4, 4 - ジメチ  
ルペンタン - 2 - オン

【 化 6 8 】



30

実施例 11 の一般方法によって、1 - [ 2, 2 - ジメチル - 3 - ( 2 - メチル - [ 1, 3  
] ジオキソラン - 2 - イル) プロピル] - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 4 -  
アミンを水性塩酸によって加水分解し、水性メタノールからの再結晶化後に 5 - ( 4 - ア  
ミノ - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - 4, 4 - ジメチルペンタン -  
2 - オンを融点 214 ~ 216 の淡黄色固形物として得た。

40

MS ( APCI ) m / z 297 ( M + H )<sup>+</sup> ;

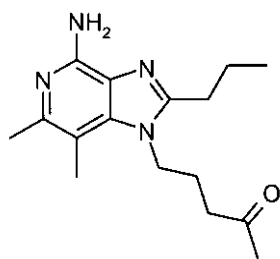
C<sub>18</sub>H<sub>22</sub>N<sub>4</sub>O の分析計算値 : C, 68 . 89 ; H, 6 . 80 ; N, 18 . 90。実測値  
: C, 68 . 91 ; H, 6 . 85 ; N, 19 . 12。

【 0 2 5 4 】

実施例 3 3

5 - ( 4 - アミノ - 6, 7 - ジメチル - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] ピリ  
ジン - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オン

## 【化 6 9】



10

## ステップ 1 :

0 で、N,N - ジメチルホルムアミド ( 6 7 5 m L ) ( DMF ) 中において、2,4 - ジクロロ - 5,6 - ジメチル - 3 - ニトロピリジン ( 1 3 5 . 0 g、0 . 4 8 8 m o l ) およびエチル 4 - アミノブチレート塩酸塩 ( 1 1 4 . 0 g、0 . 6 8 3 m o l ) を粉碎した。トリエチルアミン ( 2 7 2 . 6 m L、1 . 9 5 m o l ) を添加して褐色スラリーを生じさせた。15 分後、反応混合物が周囲温度になるまで放置して、反応を一晩撹拌した。

<sup>1</sup>H NMR による分析は、不完全な反応を示唆した。追加的量の DMF ( 2 0 0 m L ) 中のトリエチルアミン ( 1 0 2 . 2 m L、0 . 7 3 m o l ) およびエチル 4 - アミノブチレート塩酸塩 ( 3 5 . 2 8 g、0 . 1 5 9 m o l ) を反応混合物に添加して、さらに 2 4 時間撹拌した。反応混合物の半量を別々のフラスコに入れて、各フラスコに脱イオン水 ( 3 L ) を添加し、1 時間撹拌した。各フラスコ内の得られた沈殿物を濾過により収集して、減圧下で乾燥させた。粗生成物を酢酸エチルから再結晶化し、濾過して 8 6 . 2 0 g のエチル 4 - [ ( 2 - クロロ - 5,6 - ジメチル - 3 - ニトロピリジン - 4 - イル ) アミノ ] ブチレートを黄色顆粒状固形物として得た。

20

## 【 0 2 5 5】

## ステップ 2 :

アセトニトリル : 水 ( 1 0 1 2 m L ) の 9 : 1 混合物中で、エチル 4 - [ ( 2 - クロロ - 5,6 - ジメチル - 3 - ニトロピリジン - 4 - イル ) アミノ ] ブチレート ( 8 6 . 2 g、0 . 2 7 6 m o l )、ナトリウムアジ化物 ( 3 5 . 4 9 g、0 . 5 5 2 m o l )、およびセリウム塩化七水和物 ( 5 0 . 8 6 g、0 . 1 3 8 m o l ) を粉碎した。反応混合物を撹拌し、加熱して 1 8 時間還流した。反応を濾過し、黄色濾液を減圧下で濃縮して、9 0 . 9 4 g の粗生成物を得た。9 5 で 3 6 0 m L の酢酸エチルと共に同物質を粉碎し、濾過した。濾液は周囲温度で淡黄色結晶を生成し、6 4 . 3 g のエチル 4 - [ ( 5,6 - ジメチル - 8 - ニトロテトラゾロ [ 1,5 - a ] ピリジン - 7 - イル ) アミノ ] ブチレートが黄色固形物として得られた。

30

## 【 0 2 5 6】

## ステップ 3 :

エチル 4 - [ ( 5,6 - ジメチル - 8 - ニトロテトラゾロ [ 1,5 - a ] ピリジン - 7 - イル ) アミノ ] ブチレート ( 6 4 . 3 g、0 . 1 9 8 m o l ) をアセトニトリル ( 2 L ) と混合し、触媒性の炭素上の 1 0 % パラジウムを添加した。混合物を水素添加機に 7 2 時間載せて、C E L I T E 濾過助剤の層を通して濾過した。濾液を減圧下で濃縮して、5 8 . 2 g のエチル 4 - [ ( 8 - アミノ - 5,6 - ジメチルテトラゾロ [ 1,5 - a ] ピリジン - 7 - イル ) アミノ ] ブチレートを得た。

40

## 【 0 2 5 7】

## ステップ 4 :

塩化ピリジニウム ( 8 . 5 7 g、7 4 m m o l ) およびオルト - n - 酪酸トリメチルエステル ( 3 4 . 6 m L、2 1 7 m m o l ) をトルエン ( 1 1 6 5 m L ) 中で粉碎されたエチル 4 - [ ( 8 - アミノ - 5,6 - ジメチルテトラゾロ [ 1,5 - a ] ピリジン - 7 - イル ) アミノ ] ブチレート ( 5 8 . 2 g、1 9 8 m m o l ) に逐次添加し、加熱して 0 . 5 時

50

間還流した。反応混合物を減圧下で濃縮し、ジクロロメタンおよび飽和水性炭酸ナトリウムの間で分割した。有機層を単離して減圧下で濃縮し、52.99 gのエチル4-(5,6-ジメチル-8-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]テトラゾロ[1,5-a]ピリジン-7-イル)ブチレートの固形物を酢酸エチルから再結晶化して、追加的な精製なしに使用した。

**【0258】**

ステップ5:

エチル4-(5,6-ジメチル-8-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]テトラゾロ[1,5-a]ピリジン-7-イル)ブチレート(52.99 g、0.153 mol)をエタノール(550 mL)中でスラリーにし、50%水酸化ナトリウム溶液で0.5時間処理した。反応を減圧下で濃縮し、一晚維持して水(250 mL)中に溶解した。pHを5に調節して、得られた白色沈殿物を濾過した。残留物を周囲温度で粉碎して、メタノール(1 L)および減圧下で濃縮し、4-(5,6-ジメチル-8-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]テトラゾロ[1,5-a]ピリジン-7-イル)酪酸を得て、さらに精製することなく使用した。

**【0259】**

ステップ6:

5滴のN,N-ジメチルホルムアミド(DMF)を4-(5,6-ジメチル-8-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]テトラゾロ[1,5-a]ピリジン-7-イル)酪酸(36.22 g、113.8 mmol)およびジクロロメタン(725 mL)に添加した。塩化オキサリル(29.8 mL、341.3 mmol)を滴下して反応混合物に添加した。10分後、反応混合物を減圧下で濃縮し、塩化4-(5,6-ジメチル-8-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]テトラゾロ[1,5-a]ピリジン-7-イル)ブチリルを得た。

**【0260】**

ステップ7:

塩化4-(5,6-ジメチル-8-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]テトラゾロ[1,5-a]ピリジン-7-イル)ブチリル(38.39 g、114 mmol)をクロロホルム(768 mL)で粉碎し、0°Cに冷却した。N,O-ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩(16.68 g、171 mmol)およびトリエチルアミン(47.7 mL、342 mmol、滴下して添加)を反応混合物に逐次添加し、0.5時間撹拌した。飽和水性重炭酸ナトリウム溶液(400 mL)の添加後、反応混合物をさらに10分間撹拌した。有機相を単離し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮して40.01 gの4-(5,6-ジメチル-8-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]テトラゾロ[1,5-a]ピリジン-7-イル)-N-メトキシ-N-メチルブチルアミドを黄色油として得た。

**【0261】**

ステップ8:

0°Cで、4-(5,6-ジメチル-8-プロピル-1H-イミダゾ[4,5-c]テトラゾロ[1,5-a]ピリジン-7-イル)-N-メトキシ-N-メチルブチルアミド(10.0 g、27.7 mmol)およびテトラヒドロフラン(125 mL)の粉碎した混合物に、ヨウ化メチルマグネシウム(5.5 mL、41.5 mmol)を緩慢に滴下して添加した。反応を周囲温度に暖め、一晚の撹拌後に、<sup>1</sup>H NMRは反応が不完全であることを示唆した。最初の添加の18および21.75時間後に追加量のヨウ化メチルマグネシウム(5.5 mL、41.5 mmol)を添加した。ヨウ化メチルマグネシウムの最後の添加(3.6 mL、27 mmol)を最初の添加の23時間後に添加し、さらに1時間反応させた。続く1N水性水素塩化溶液(35 mL)の添加によって山吹色のスラリーが生じ、混合物を減圧下で濃縮した。残留物をジクロロメタン(200 mL)中に溶解し、飽和水性重炭酸ナトリウム(100 mL)で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮して8.15 gの5-(5,6-ジメチル-8-プロピル-1H-イミダゾ[4,5

- c ]テトラゾロ [ 1,5 - a ]ピリジン - 7 - イル)ペンタン - 2 - オンをさらに精製することなく得た。

【0262】

ステップ9:

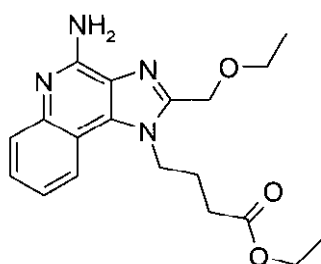
トリフェニルホスフィン (13.5 g、51.5 mmol) を 5 - (5,6 - ジメチル - 8 - プロピル - 1H - イミダゾ [4,5 - c] テトラゾロ [1,5 - a] ピリジン - 7 - イル)ペンタン - 2 - オン (8.15 g、25.8 mmol) および 1,2 - ジクロロベンゼン (163 mL) の混合物に添加し、133 で13.5時間加熱した。さらに1.5時間かけて反応温度を徐々に140 に増大させた。次に追加的なトリフェニルホスフィン (3.39 g、12.9 mmol) を添加して、反応をさらに1時間加熱した。得られた暗色褐色溶液を周囲温度に冷却し、減圧下で濃縮した。得られた残留物をメタノール (150 mL) 中に溶解し、1N水性塩酸 (75 mL) を添加してスラリーを作り出した。反応を40 で1時間攪拌し、その後得られた混合物を濾過し、減圧下で濃縮してジクロロメタン (100 mL) に溶解し、1N水性塩酸で洗浄した。飽和水性重炭酸ナトリウムおよび50%水酸化ナトリウム溶液で水性層をpH14に調節し、生成物をクロロホルム (250 mL) 中に抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して4.61gの褐色固形物質を得た。同物質をアセトニトリルから再結晶化して2.53gの単離された物質を得た。バイオテージ・ホライゾン (BIOTAGE HORIZON) 高性能フラッシュクロマトグラフィ装置上のカラムクロマトグラフィ (0:100 ~ 40:60の範囲のクロロホルム/メタノール/水酸化アンモニウム (80/18/2):クロロホルムでの溶出) によって物質の一部 (1.22 g) を精製し、0.81gの5 - (4 - アミノ - 6,7 - ジメチル - 2 - プロピル - 1H - イミダゾ [4,5 - c] ピリジン - 1 - イル)ペンタン - 2 - オンを融点148.5 ~ 149.5 の灰白色の粉末として得た。<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, DMSO - d<sub>6</sub>) 5.58 (s, 2H)、4.16 (t, J = 8.1 Hz, 2H)、2.77 (t, J = 8.1 Hz, 2H)、2.58 (t, J = 6.9 Hz, 2H)、2.37 (s, 3H)、2.30 (s, 3H)、2.10 (s, 3H)、1.80 (m, J = 7.5 Hz, 4H)、1.00 (t, J = 7.5 Hz, 3H; MS (APCI) m/z 289 (M + H)<sup>+</sup>; C<sub>20</sub>H<sub>26</sub>N<sub>6</sub>O<sub>2</sub>の分析計算値: C, 66.64; H, 8.39; N, 19.43。実測値: C, 66.40; H, 8.63; N, 19.44。

【0263】

実施例34

エチル 4 - [4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1H - イミダゾ [4,5 - c] キノリン - 1 - イル]ブタノエート

【化70】



ステップ1:

室温で、ジクロロメタン (100 mL) 中のエチル 4 - (3 - アミノキノリン - 4 - イルアミノ)ブチレート (実施例17のステップ1~2で述べられるようにして調製される、12.5 g、45.7 mmol) の攪拌される溶液に、ジクロロメタン (10 mL) 中

の塩化エトキシアセチル (7.00 g、57.1 mmol) の溶液を滴下して添加した。1.5 時間後、反応混合物を減圧下で濃縮し、固形物を得て、それにエタノール (100 mL) およびトリエチルアミン (17.4 mL、125 mmol) を添加した。溶液を室温に5日間放置し、次に加熱して2時間還流した。溶液を減圧下で濃縮した。残留物をジクロロメタン (150 mL) および水 (50 mL) の間で分割した。有機層を水 (50 mL) および飽和水性重炭酸ナトリウム (50 mL) で洗浄し、炭酸カリウム上で乾燥させ、濾過して減圧下で濃縮して、15.4 gのエチル 4 - [ 2 - (エトキシメチル) - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ] ブタノエートを褐色油として得て、精製することなく次のステップで使用した。

【0264】

ステップ 2 :

0 で、ジクロロメタン (150 mL) 中のエチル 4 - [ 2 - (エトキシメチル) - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ] ブタノエート (15.4 g、45.1 mmol) の攪拌される溶液に、mCPBA (およそ77%純度、19.7 g、87.9 mmol) を小分けして添加した。反応混合物を室温で1.5時間攪拌し、次に濃水酸化アンモニウム (50 mL) を添加した。混合物に塩化 p - トルエンスルホニルを小分けして添加し、それを1時間攪拌して次に濾過した。濾液を分液漏斗に移し飽和水性重炭酸ナトリウム (50 mL) を添加すると、層が分離した。水性層をジクロロメタン (2 x 50 mL) で抽出した。有機層を合わせて5%水性水酸化ナトリウム (2 x 75 mL) で洗浄し、炭酸カリウム上で乾燥させ、濾過して減圧下で濃縮して褐色固形物を得て、それを酢酸エチル (50 mL) 中でスラリーにし濾過した。濾液を減圧下で濃縮し、固形物をエタノール/水から4回再結晶化し、次にジクロロメタン (100 mL) に溶解した。溶液を飽和水性重炭酸ナトリウム (2 x 50 mL) で洗浄し、次に減圧下で濃縮して固形物を得て、それをエタノール/水から3回再結晶化した。結晶を70 の真空オープン内で乾燥させ、エチル 4 - [ 4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ] ブタノエートを融点129 ~ 131 の淡黄色結晶として得た。MS (APCI) m/z 357 (M + H<sup>+</sup>) ;

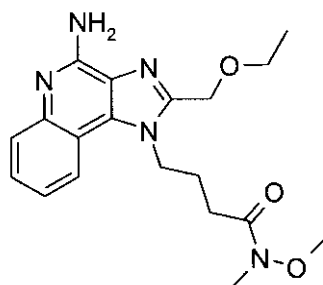
C<sub>19</sub>H<sub>24</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>の分析計算値 : C, 64.03 ; H, 6.79 ; N, 15.72。実測値 : C, 63.76 ; H, 6.89 ; N, 15.49。

【0265】

実施例 35

4 - [ 4 - アミノ - 2 - (エトキシメチル) - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ] - N - メトキシ - N - メチルブタンアミド

【化71】



ステップ 1 :

0 で、ジクロロメタン (100 mL) 中の N, O - ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩 (6.81 g、69.9 mmol) の攪拌される懸濁液に、トルエン (2 M、35 mL、70 mmol) 中のトリメチルアルミニウム溶液を添加した。反応混合物を 0 C で15分間、次に再度 0 C に冷却する前に室温で15分間攪拌した。ジクロロメタン (50

10

20

30

40

50

mL) 中のエチル 4 - [ 2 - ( エトキシメチル ) - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ] ブタノエート ( 実施例 3 4 のステップ 1 で述べられるようにして調製される ) の溶液を添加した。15 分後、反応混合物が室温に暖まるまで放置し、次に加熱して 2 日間還流した。反応混合物が室温に冷却するまで放置し、ジクロロメタン ( 150 mL ) を添加した。メタノール ( 10 mL ) 、続いて 10 % 水性塩酸 ( 10 mL ) を緩慢に添加した。混合物に飽和水性重炭酸ナトリウムを添加した。混合物を分液漏斗に移して、層が分離した。水性層をジクロロメタンで抽出した。有機層を合わせて飽和水性重炭酸ナトリウムで洗浄した、炭酸カリウム上で乾燥させ、濾過して減圧下で濃縮し 13.9 g の油を得て、それを精製することなく次のステップで使用した。

【 0 2 6 6 】

ステップ 2 :

ステップ 1 ( 13.9 g ) からの物質を実施例 3 4 のステップ 2 で述べられる一般条件に従って処理した。粗生成物を酢酸エチル中でスラリーにして濾過した。濾液を濃縮し、フラッシュクロマトグラフィー ( シリカゲル、容積で 0.4 % の濃水酸化アンモニウムを含有するジクロロメタン溶液中の 7 % メタノールでの溶出 ) によって精製し、油を得て、それを酢酸エチルとともに粉碎した。固形物が形成し、それを濾過によって単離してメタノール / 水から 2 回再結晶化した。結晶を 70 の真空オープン内で一晩乾燥させ、1.59 g の 4 - [ 4 - アミノ - 2 - ( エトキシメチル ) - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ] - N - メトキシ - N - メチルブタンアミドを融点 163 ~ 165 の淡黄色固形物として得た。

MS ( APC I ) m / z 372 ( M + H<sup>+</sup> ) ;

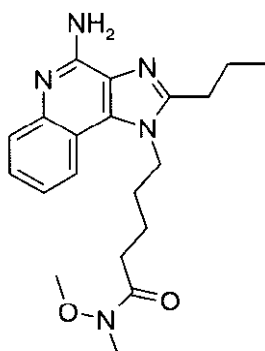
C<sub>19</sub>H<sub>25</sub>N<sub>5</sub>O<sub>3</sub> の分析計算値 : C , 61.44 ; H , 6.78 ; N , 18.85。実測値 : C , 61.48 ; H , 6.82 ; N , 18.68。

【 0 2 6 7 】

実施例 3 6

5 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - N - メトキシ - N - メチルペンタンアミド

【 化 7 2 】



ステップ 1 :

クロロホルム ( 1 L ) 中の 4 - クロロ - 3 - ニトロキノリン ( 100 g、0.470 mol ) 混合物に、炭酸カリウム ( 66.23 g、0.479 mol )、トリエチルアミン ( 167 mL、1.20 mol )、および 5 - アミノ吉草酸エチル塩酸塩 ( 104 g、0.575 mol ) を添加した。反応混合物を室温で 4 時間攪拌し、次に水 ( 200 mL ) を添加した。混合物を分液漏斗に移し、層が分離した。有機層を飽和水性重炭酸ナトリウムおよび鹼水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濾過して減圧下で濃縮し 151 g のエチル 5 - [ ( 3 - ニトロキノリン - 4 - イル ) アミノ ] ペンタノエートを得た。

【 0 2 6 8 】

10

20

30

40

50

## ステップ 2 :

実施例 6 のステップ 2 で述べられる一般方法を使用して、エチル 5 - [ ( 3 - ニトロキノリン - 4 - イル ) アミノ ] ペンタノエート ( 151 g、0.476 mol ) を 131.5 g の粗製エチル 5 - [ ( 3 - アミノキノリン - 4 - イル ) アミノ ] ペンタノエートに還元し、それを精製することなく次のステップで使用した。

【0269】

## ステップ 3 :

実施例 6 のステップ 3 で述べられる一般方法を使用して、トリエチルオルト酢酸に代えてオルト酪酸トリメチルを使用して、粗製エチル 5 - [ ( 3 - アミノキノリン - 4 - イル ) アミノ ] ペンタノエート ( 26.3 g、91.5 mmol ) を 28 g の粗製エチル 5 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタノエートに転換した。

10

【0270】

## ステップ 4 :

エタノール ( 100 mL ) 中のエチル 5 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタノエート ( 14.6 g、43.0 mmol ) の溶液に、水 ( 100 mL ) 中の水酸化ナトリウム ( 2.23 g、55.9 mmol ) の溶液を添加した。反応混合物を室温で一晩攪拌し、次に減圧下でエタノールを除去した。残る水性溶液をジクロロメタンで洗浄し、10% の水性塩酸で pH 5 に調節した。水性層をジクロロメタン ( 2x ) で抽出した。後に有機層を合わせて硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濾過して濃縮し 11.5 g の 5 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン酸を黄色固形物として得た。

20

【0271】

## ステップ 5

室温で、ジクロロメタン ( 50 mL ) 中の 5 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタン酸 ( 5.21 g、16.7 mmol ) の溶液に塩化オキサリル ( 2.62 mL、30.1 mmol ) を添加した。反応を 1 時間攪拌し、次に揮発性物質を減圧下で除去した。残留物にジクロロメタン ( 50 mL )、続いて N, O - ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩 ( 3.26 g、33.5 mmol )、および N, N - ジメチルホルムアミド ( 2 mL ) を添加した。反応混合物を室温で一晩攪拌し、次に減圧下で濃縮した。残留物をジクロロメタンおよび水酸化アンモニウム溶液で希釈した。混合物を分液漏斗に移して、層が分離された。有機層を飽和水性重炭酸ナトリウムおよび鹼水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濾過して減圧下で濃縮し 5.5 g の粗製 N - メトキシ - N - メチル - 5 - ( 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) ペンタンアミドを褐色油として得て、精製することなく次のステップで使用した。

30

【0272】

## ステップ 6 :

実施例 34 のステップ 2 で述べられる手順の変法に従って、ステップ 5 からの物質を処理した。分液漏斗を使用して、反応混合物を層分離させて精錬した。有機層を飽和水性重炭酸ナトリウムおよび鹼水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濾過して減圧下で濃縮した。フラッシュクロマトグラフィ ( シリカゲル、ジクロロメタン中の 10% メタノールによる溶出 ) によって、粗製 5 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - N - メトキシ - N - メチルペンタンアミドを精製し、固形物を得た。固形物にアセトンを添加し、混合物を超音波処理した。濾過によって固形物を単離し、80 の真空オープン内で乾燥させ、5 - ( 4 - アミノ - 2 - プロピル - 1 H - イミダゾ [ 4, 5 - c ] キノリン - 1 - イル ) - N - メトキシ - N - メチルペンタンアミドを融点 150 ~ 151 のベージュ針状晶として得た。

40

MS ( APC I ) m / z 370.1 ( M + H<sup>+</sup> ) ;C<sub>20</sub>H<sub>27</sub>N<sub>5</sub>O<sub>2</sub> · 0.15 H<sub>2</sub>O の分析計算値 : C, 64.51 ; H, 7.40 ; N, 1

50

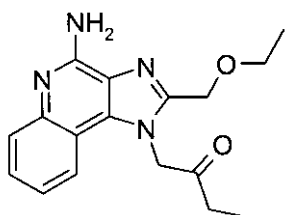
8.81。実測値：C, 64.16; H, 7.40; N, 18.81。

【0273】

実施例37

1-[4-アミノ-2-(エトキシメチル)-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル]ブタン-2-オン

【化73】



10

ステップ1:

I.L.リセンコ(Lysenko)およびO.G.クリンコビッチ(Kulinkovich)、Russ.J.Org.Chem.、37、pp.1238~1243(2001)の方法を使用して1-(アミノメチル)シクロプロパノールを調製した。0で、ジクロロメタン(120mL)中の1-(アミノメチル)シクロプロパノール(36.7mmol)およびトリエチルアミン(6.30mL、45.4mmol)の攪拌される懸濁液に、ジクロロメタン(30mL)中の4-クロロ-3-ニトロキノリン(7.28g、34.9mmol)の溶液を滴下して添加した。混合物を室温で3日間攪拌し、次に減圧下で濃縮した。残留物を水(150mL)に懸濁し、3時間攪拌した。固形物を濾過によって単離し、水(50mL)で洗浄して75の真空オープン内で乾燥させ、8.99gの1-{[(3-ニトロキノリン-4-イル)アミノ]メチル}シクロプロパノールを黄色固形物として得た。

20

【0274】

ステップ2:

水素の35psi(2.4x10<sup>5</sup>Pa)のパール装置上で、酢酸エチル(80mL)およびメタノール(8mL)中の1-{[(3-ニトロキノリン-4-イル)アミノ]メチル}シクロプロパノール(4.00g、15.4mmol)および炭素上の5%白金(400mg)の混合物を室温で3時間水素付加した。混合物をCELITE濾材を通して濾過し、それを10%メタノール/酢酸エチルですすいだ。濾液をオレンジ色の油に濃縮し、それを次のステップで直接使用した。

30

【0275】

ステップ3:

ステップ2からの物質をジクロロメタン(70mL)に溶解した。溶液を0に冷却し、塩化エトキシアセチル(1.7mL、16.9mmol)を滴下して添加した。反応混合物を0で1時間攪拌し、次に溶剤を減圧下で除去した。残留物を次のステップで直接使用した。

40

【0276】

ステップ4:

ステップ3からの物質をエタノール(70mL)に溶解し、2Mの水性水酸化ナトリウム(15mL、30.8mmol)を添加した。反応混合物を60で1時間加熱し、次に室温で一晩攪拌した。揮発性物質を減圧下で除去し、得られた残留物にジクロロメタン(70mL)および水(50mL)を添加した。1MのHClで混合物をpH7に調節した。層が分離し、水性層をジクロロメタン(25mL)で抽出した。有機層を合わせて硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濾過して濃縮し、4.23gの粗製1-[2-(エトキシ

50

メチル) - 1H - イミダゾ[4,5-c]キノリン - 1 - イル]ブタン - 2 - オンを黄褐色固形物として得た。

【0277】

ステップ5:

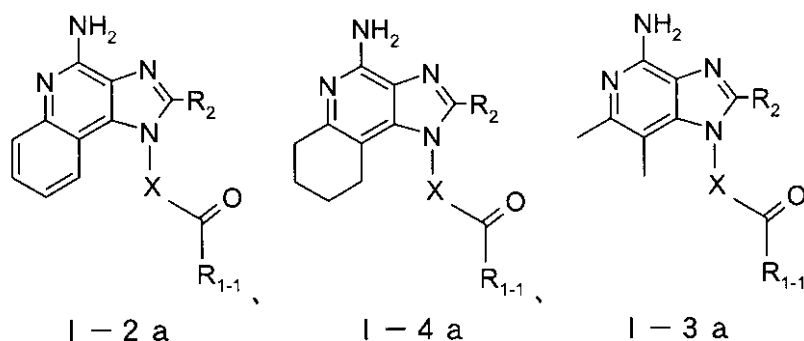
室温で、クロロホルム(30 mL)中の1-[2-(エトキシメチル)-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル]ブタン-2-オン(1.96 g、6.59 mmol)の溶液に、mCPBA(2.11 g、8.57 mmol)を添加した。反応混合物を1時間攪拌し、次に0℃に冷却した。濃水酸化アンモニウム(10 mL)および塩化p-トルエンスルホン(1.38 g、7.25 mmol)を添加した。混合物を0℃で1時間攪拌し、次に濾過した。濾液をジクロロメタン(50 mL)および飽和水性重炭酸ナトリウム(50 mL)で希釈した。層が分離し、水性層をジクロロメタン(25 mL)で抽出した。有機層を合わせて硫酸マグネシウム上で乾燥させ、濾過して濃縮し褐色固形物を得た。米国バージニア州シャーロットビルのパイオテージ(Biotage, Inc (Charlottesville, Virginia, USA))から入手できるホライゾン(HORIZON)高性能フラッシュクロマトグラフィー(HPFC)装置上でのクロマトグラフィー(シリカゲル、クロロホルム中の80%CHCl<sub>3</sub>、18%MeOH、および2%濃NH<sub>4</sub>OH(CMA)を含んでなる0~35%の溶液による勾配溶出)によって固形物を精製し、黄褐色固形物を得て、それをクロロホルム/ヘキサンから再結晶化した。結晶を濾過によって単離し、80℃の真空オープン内で乾燥させて、0.718 gの1-[4-アミノ-2-(エトキシメチル)-1H-イミダゾ[4,5-c]キノリン-1-イル]ブタン-2-オンを融点187~188℃の淡いピンクの針状晶として得た。MS(APCI)m/z313(M+H)<sup>+</sup>;  
C<sub>17</sub>H<sub>20</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>の分析計算値:C, 65.37; H, 6.45; N, 17.94。実測値:C, 65.22; H, 6.19; N, 17.71。

【0278】

例示的な化合物

実施例で上述したもののいくつかをはじめとする特定の例示的な化合物は、以下の式(I-2a、I-4a、およびI-3a)を有し、式中、X、R<sub>2</sub>、およびR<sub>1-1</sub>はすぐ下の表中で定義される。この表では、各環系について、各行が1つの具体的化合物を表す。

【化74】



【0279】

10

20

30

40

【表 1】

R <sub>2</sub>	X	R <sub>1-1</sub>
H (水素)	-CH <sub>2</sub> -	メチル
H	-CH <sub>2</sub> -	エチル
H	-CH <sub>2</sub> -	n-プロピル
H	-CH <sub>2</sub> -	イソプロピル
H	-CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
H	-CH <sub>2</sub> -	n-ブチル
H	-CH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
H	-CH <sub>2</sub> -	イソブチル
H	-CH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
H	-CH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
H	-CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
H	-CH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
H	-CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
H	-CH <sub>2</sub> -	フェニル
H	-CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
H	-CH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-プロピル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ブチル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	sec-ブチル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	tert-ブチル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ペンチル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	メチル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	エチル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-プロピル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソプロピル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロプロピル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ブチル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	sec-ブチル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソブチル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	tert-ブチル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ペンチル

10

20

30

40

【表 2】

(〈表1〉のつづき)

H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロペンチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ヘキシル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロヘキシル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	フェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	4-クロロフェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	メチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	エチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-プロピル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソプロピル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロプロピル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	sec-ブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	tert-ブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ペンチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロペンチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ヘキシル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロヘキシル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	フェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	4-クロロフェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	メチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	エチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-プロピル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソプロピル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロプロピル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	sec-ブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	tert-ブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ペンチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロペンチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ヘキシル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロヘキシル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	フェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	4-クロロフェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	メチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	エチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-プロピル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソプロピル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロプロピル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ブチル

10

20

30

40

【表3】

(＜表1＞のつづき)

H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	sec-ブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	tert-ブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ペンチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロペンチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ヘキシル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロヘキシル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	フェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	4-クロロフェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-プロピル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ブチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	sec-ブチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	tert-ブチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ペンチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	メチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	エチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-プロピル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソプロピル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ブチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソブチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	フェニル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
H	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル

10

20

30

40

【表 4】

(＜表 1＞のつづき)

H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-プロピル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	フェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-プロピル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	フェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
H	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	フェニル

10

20

30

40

【表 5】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ペンチル

10

20

30

40

【表 6】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ブチル

10

20

30

40

【表 7】

(〈表 1〉のつづき)

-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	<i>sec</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	<i>tert</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -プロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	<i>sec</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	<i>tert</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -プロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>sec</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>tert</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル

10

20

30

40

【表 8】

( &lt; 表 1 &gt; のつづき)

-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>3</sub> (メチル)	-CH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル

10

20

30

40

【表 9】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	メチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	エチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	フェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	メチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	エチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	フェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	メチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	エチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ペンチル

10

20

30

40

【表 10】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	フェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	メチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	エチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	フェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ブチル

10

20

30

40

【表 1 1】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	<i>sec</i> -ブチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	<i>tert</i> -ブチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ペンチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -プロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>sec</i> -ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>tert</i> -ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ペンチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -プロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>sec</i> -ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>tert</i> -ブチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ペンチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> (エチル)	-CH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	エチル

10

20

30

40

【表 1 2】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	フェニル

10

20

30

40

【表 1 3】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ペンチル

10

20

30

40

【表 1 4】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	nヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	nプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	nブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	nペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	nヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	nプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	nブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	nペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	nヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	nプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	nブチル

10

20

30

40

【表 15】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> (n-プロピル)	-CH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル

10

20

30

40

【表 1 6】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	フェニル

10

20

30

40

【表 17】

(〈表 1〉のつづき)

-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ペンチル

10

20

30

40

【表 18】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ブチル

10

20

30

40

【表 19】

(〈表1〉のつづき)

-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>sec</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>tert</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ( <i>n</i> -ブチル)	-CH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	<i>sec</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	<i>tert</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	<i>n</i> -プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	<i>sec</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	<i>tert</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	メチル

10

20

30

40

【表 2 0】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロヘキシル

10

20

30

40

【表 2 1】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	tert-ブチル

10

20

30

40

【 0 3 0 0 】

【表 2 2】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> (エトキシメチル)	-CH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	イソプロピル

10

20

30

40

【 0 3 0 1 】

【表 2 3】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	2,4-ジクロロフェニル

10

20

30

40

【表 2 4】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	<i>n</i> -プロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	<i>n</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	<i>sec</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	<i>tert</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	<i>n</i> -ペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	<i>n</i> -ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	<i>n</i> -プロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	<i>n</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	<i>sec</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	<i>tert</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	<i>n</i> -ペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	<i>n</i> -ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	<i>n</i> -プロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	<i>n</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	<i>sec</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	<i>tert</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	<i>n</i> -ペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	<i>n</i> -ヘキシル

10

20

30

40

【表 2 5】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソブチル

10

20

30

40

【表 2 6】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>tert</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -プロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>sec</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>tert</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> (2-メトキシエチル)	-CH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	<i>sec</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	<i>tert</i> -ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	<i>n</i> -ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	<i>n</i> -プロピル

10

20

30

40

【 0 3 0 5 】

【表 27】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	4-クロロフェニル

10

20

30

40

【表 2 8】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -	2, 4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロペンチル

10

20

30

40

【 0 3 0 7 】

【表 2 9】

(＜表 1＞のつづき)

-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	sec-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	tert-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロペンチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロヘキシル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	フェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	4-クロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	2,4-ジクロロフェニル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	メチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	エチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-プロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	イソプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	シクロプロピル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	n-ブチル
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> -	sec-ブチル

10

20

30

40

【表 3 0】

(＜表 1＞のつづき)

$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$-(\text{CH}_2)_3\text{OCH}_2-$	イソブチル
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$-(\text{CH}_2)_3\text{OCH}_2-$	<i>tert</i> -ブチル
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$-(\text{CH}_2)_3\text{OCH}_2-$	<i>n</i> -ペンチル
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$-(\text{CH}_2)_3\text{OCH}_2-$	シクロペンチル
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$-(\text{CH}_2)_3\text{OCH}_2-$	<i>n</i> -ヘキシル
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$-(\text{CH}_2)_3\text{OCH}_2-$	シクロヘキシル
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$-(\text{CH}_2)_3\text{OCH}_2-$	フェニル
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$-(\text{CH}_2)_3\text{OCH}_2-$	4-クロロフェニル
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$-(\text{CH}_2)_3\text{OCH}_2-$	2,4-ジクロロフェニル

10

## 【 0 3 0 9 】

ヒト細胞におけるサイトカイン誘導

本発明の化合物は、下で述べる方法を使用して試験すると、サイトカイン生合成を誘導することが分かった。

## 【 0 3 1 0 】

生体外 (*in vitro*) ヒト血液細胞系を使用してサイトカイン誘導を評価した。活性はテスターマン (Testerman) ら著「免疫調節物質イミキモドおよび S - 27609 によるサイトカイン誘導 (Cytokine Induction by the Immunomodulators Imiquimod and S - 27609)」、*Journal of Leukocyte Biology*、58、365 ~ 372 (9月、1995) で述べられるようにして、培地内に分泌されるインターフェロンおよび腫瘍壊死因子 ( ) (それぞれ IFN および TNF) の測定に基づく。

20

## 【 0 3 1 1 】

培養のための血液細胞調製

健康なヒトドナーからの全血を EDTA 真空採血管内への静脈穿刺によって採取した。ヒストパック (HISTOPAQUE) - 1077 を使用して、濃度勾配遠心分離によって末梢血単核細胞 (PBMC) を全血から分離した。ダルベッコのリン酸緩衝塩類溶液 (DPBS) またはハクス平衡塩類溶液 (HBSS) で血液を 1 : 1 に希釈した。PBMC 層を収集して DPBS または HBSS で 2 回洗浄し、完全 RPMI 中で  $4 \times 10^6$  細胞 / mL に再懸濁した。試験化合物を含有する等容積の RPMI 完全培地を含有するマサチューセッツ州ケンブリッジのコスター (Costar (Cambridge, MA) またはニュージャージー州リンカーンパークのベクトンディイソンラブウェア (Becton Dickinson Labware (Lincoln Park, NJ)) から) の 48 ウェル平底滅菌組織培養プレートに、PBMC 懸濁液を入れた。

30

## 【 0 3 1 2 】

化合物の調製

化合物をジメチルスルホキシド (DMSO) 中で可溶化した。培養ウェルへの添加に際し、DMSO 濃度は 1 % の最終濃度を超えるべきでない。化合物は概して  $30 \sim 0.014 \mu\text{M}$  の範囲の濃度で試験された。

40

## 【 0 3 1 3 】

培養

完全 RPMI を含有する第 1 のウェルに、試験化合物溶液を  $60 \mu\text{M}$  で添加、一連の 3 倍希釈をウェル中に行った。次に PBMC 懸濁液を等容積でウェルに添加して、試験化合物濃度を所望の範囲 ( $30 \sim 0.014 \mu\text{M}$ ) にする。PBMC 懸濁液の最終濃度は  $2 \times 10^6$  細胞 / mL であった。プレートを滅菌プラスチック蓋で覆い、穏やかに混合して、次に 5 % 二酸化炭素雰囲気内で 37 °C において 18 ~ 24 時間培養した。

50

## 【0314】

## 分離

培養に続いて、プレートを4 において1000rpm(およそ200×g)で10分間遠心分離した。細胞フリーの培養上清を滅菌ポリプロピレンピペットで取り除き、滅菌ポリプロピレン試験管に移した。サンプルを分析まで-30~-70 に維持した。サンプルをインターフェロン( )についてELISAによって分析し、腫瘍壊死因子( )についてELISAまたはIGENアッセイによって分析した。

## 【0315】

ELISAによるインターフェロン( )および腫瘍壊死因子( )の分析

ニュージャージー州ブランズウィックのPBLバイオメディカルラボラトリーズ(PBL Biomedical Laboratories(New Brunswick, NJ))からのヒト複数種キットを使用して、ELISAによってインターフェロン( )濃度を判定する。結果をpg/mLで表す。

10

## 【0316】

カリフォルニア州カマリロのバイオソースインターナショナル(Biosource International(Camarillo, CA))から入手できるELISAキットを使用して、腫瘍壊死因子( ) (TNF)濃度を判定する。代案としては、オリジンMシリーズ(ORIGEN M-Series)イムノアッセイによってTNF濃度を判定し、メリーランド州ゲイサースバーグのIGENインターナショナル(IGEN International(Gaithersburg, MD))からのIGENM-8分析機上で読み取ることができる。イムノアッセイは、カリフォルニア州カマリロのバイオソースインターナショナル(Biosource International(Camarillo, CA))からのヒトTNF捕獲および検出抗体ペアを使用する。結果をpg/mLで表す。

20

## 【0317】

ここで引用した完全な特許の開示、特許文献、および公報は、その全体を個々に編入したものとして参照により援用する。本発明の範囲と精神を逸脱することなく本発明の様々な変更と修正が可能であることは、当業者には明らかである。本発明はここに記載される例証的な実施態様および実施例によって不当に制限されないものとし、このような実施例および実施態様は例としてのみ提示され、本発明の範囲は、冒頭に記載の特許請求の範囲によってのみ制限されるものとする。

30

## 【手続補正書】

【提出日】平成23年10月25日(2011.10.25)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

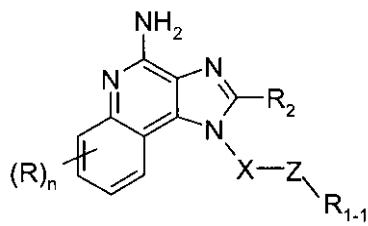
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式(I-2)：

## 【化 1】



I-2

{ 式中、

X は任意に 1 つ以上の - O - 基によって中断されるアルキレンであり、

n は 0 ~ 4 の整数であり、

Z は  $-C(-Q-R_{1-3})_2-$  であり、R<sub>1-1</sub> は、

水素、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、

ジアルキルアミノ、

アルキルチオ、

ハロアルキル、

ハロアルコキシ、

アルキル、

- NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、- NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、- NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、- NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および- N<sub>3</sub>

からなる群から選択される 1 つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、

Q は O であり、

R<sub>1-3</sub> は、

アルキル、

アリール、

アルキレン - アリール、

ヘテロアリール、

アルキレン - ヘテロアリール、並びに

ハロゲン、

シアノ、

ニトロ、

アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、  
 - NH - SO<sub>2</sub> - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - R<sub>1-4</sub>、  
 - NH - C(O) - NH<sub>2</sub>、  
 - NH - C(O) - NH - R<sub>1-4</sub>、および  
 - N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、

または R<sub>1-3</sub>基は一緒になって飽和または不飽和5 -、6 -、または7 - 員環を含んでなる環系を形成でき、

R<sub>1-4</sub>は、  
 アルキル、  
 アリール、  
 アルキレン - アリール、  
 ヘテロアリール、  
 アルキレン - ヘテロアリール、並びに  
 ハロゲン、  
 シアノ、  
 ニトロ、  
 アルコキシ、  
 ジアルキルアミノ、  
 アルキルチオ、  
 ハロアルキル、  
 ハロアルコキシ、  
 アルキル、および  
 - N<sub>3</sub>

からなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換された、アルキル、アリール、アルキレン - アリール、ヘテロアリール、またはアルキレン - ヘテロアリールからなる群から選択され、そして

Rは、  
 フルオロ、  
 アルキル、  
 ハロアルキル、  
 アルコキシ、および

- N(R<sub>9</sub>)<sub>2</sub>

からなる群から選択され、

R<sub>2</sub>は、

- R<sub>4</sub>、  
 - X' - R<sub>4</sub>、  
 - X' - Y' - R<sub>4</sub>、および  
 - X' - R<sub>5</sub>

からなる群から選択され、

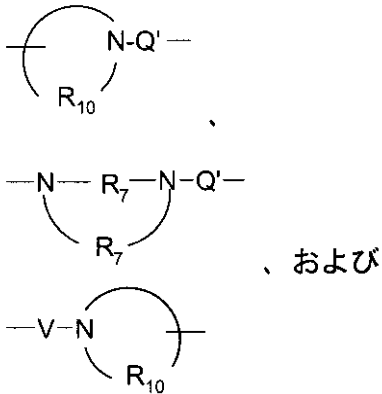
X'はアルキレン、アルケニレン、アルキニレン、アリーレン、およびヘテロアリーレンからなる群から選択され、ここで前記アルキレン、アルケニレン、およびアルキニレン基

は任意にアリーレンまたはヘテロアリーレンによって中断または終端されることができ、任意に1つ以上の-O-基によって中断され、

Y' は、

- S ( O )<sub>0-2</sub> - 、
- S ( O )<sub>2</sub> - N ( R<sub>8</sub> ) - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - O - 、
- O - C ( R<sub>6</sub> ) - 、
- O - C ( O ) - O - 、
- N ( R<sub>8</sub> ) - Q' - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - N ( R<sub>8</sub> ) - 、
- O - C ( R<sub>6</sub> ) - N ( R<sub>8</sub> ) - 、
- C ( R<sub>6</sub> ) - N ( O R<sub>9</sub> ) - 、

【化2】



からなる群から選択され、

R<sub>4</sub>は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニルからなる群から選択され、ここで前記アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキレニル、アリールオキシアルキレニル、アルキルアリーレニル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキレニル、ヘテロアリールオキシアルキレニル、およびアルキルヘテロアリーレニル基は、非置換でもまたは独立してアルキル、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロゲン、ニトロ、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、アリール、アリールオキシ、アリールアルキレンオキシ、ヘテロアリール、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールアルキレンオキシ、ヘテロシクリル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、(ジアルキルアミノ)アルキレンオキシ、そしてアルキル、アルケニル、およびアルキニルの場合は、さらにオキソからなる群から選択される1つ以上の置換基によって置換されていることもでき、

R<sub>5</sub>は



## フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I	テーマコード(参考)
A 6 1 P 31/12 (2006.01)	A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 37/04 (2006.01)	A 6 1 P 33/06	
A 6 1 P 11/08 (2006.01)	A 6 1 P 31/12	
A 6 1 P 31/16 (2006.01)	A 6 1 P 37/04	
A 6 1 P 31/14 (2006.01)	A 6 1 P 11/08	
A 6 1 P 31/18 (2006.01)	A 6 1 P 31/16	
A 6 1 P 31/22 (2006.01)	A 6 1 P 31/14	
A 6 1 P 25/28 (2006.01)	A 6 1 P 31/18	
A 6 1 P 31/10 (2006.01)	A 6 1 P 31/22	
A 6 1 P 37/06 (2006.01)	A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 31/04 (2006.01)	A 6 1 P 31/10	
A 6 1 P 35/02 (2006.01)	A 6 1 P 37/06	
A 6 1 P 31/06 (2006.01)	A 6 1 P 31/04	
A 6 1 K 39/39 (2006.01)	A 6 1 P 35/02	
A 6 1 P 43/00 (2006.01)	A 6 1 P 31/06	
	A 6 1 K 39/39	
	A 6 1 P 43/00	1 2 1
	A 6 1 P 43/00	1 1 1

(74)代理人 100117019

弁理士 渡辺 陽一

(74)代理人 100141977

弁理士 中島 勝

(74)代理人 100127085

弁理士 越阪部 倫子

(72)発明者 クレブスキー, ラリー アール.

アメリカ合衆国, ミネソタ 5 5 1 3 3 - 3 4 2 7, セント ポール, ポスト オフィス ボックス 3 3 4 2 7, スリーエム センター

(72)発明者 デラリア, ジョセフ エフ., ジュニア

アメリカ合衆国, ミネソタ 5 5 1 3 3 - 3 4 2 7, セント ポール, ポスト オフィス ボックス 3 3 4 2 7, スリーエム センター

(72)発明者 ダフィー, ダニエル イー.

アメリカ合衆国, ミネソタ 5 5 1 3 3 - 3 4 2 7, セント ポール, ポスト オフィス ボックス 3 3 4 2 7, スリーエム センター

(72)発明者 ラドマー, マシュー アール.

アメリカ合衆国, ミネソタ 5 5 1 3 3 - 3 4 2 7, セント ポール, ポスト オフィス ボックス 3 3 4 2 7, スリーエム センター

(72)発明者 アモス, デイビッド ティー.

アメリカ合衆国, ミネソタ 5 5 1 3 3 - 3 4 2 7, セント ポール, ポスト オフィス ボックス 3 3 4 2 7, スリーエム センター

F ターム(参考) 4C065 AA05 AA18 BB06 CC09 DD03 EE02 HH01 JJ07 KK01 KK02

KK04 PP03 PP07 QQ05

4C085 AA38 FF17

4C086 AA01 AA02 AA03 CB05 GA13 MA02 MA05 NA05 NA14 ZA02

ZA16 ZA34 ZA51 ZA59 ZA61 ZA75 ZB05 ZB07 ZB08 ZB13

ZB21 ZB26 ZB27 ZB33 ZB35 ZB37 ZB38 ZC55 ZC75