

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成22年8月5日(2010.8.5)

【公表番号】特表2010-507619(P2010-507619A)

【公表日】平成22年3月11日(2010.3.11)

【年通号数】公開・登録公報2010-010

【出願番号】特願2009-533834(P2009-533834)

【国際特許分類】

C 0 7 D 285/135	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/28	(2006.01)
A 6 1 P 25/18	(2006.01)
A 6 1 P 25/24	(2006.01)
A 6 1 P 25/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/16	(2006.01)
A 6 1 P 25/14	(2006.01)
A 6 1 P 21/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/08	(2006.01)
A 6 1 P 25/04	(2006.01)
A 6 1 P 25/06	(2006.01)
A 6 1 P 25/20	(2006.01)
A 6 1 P 9/06	(2006.01)
A 6 1 P 9/10	(2006.01)
A 6 1 P 1/12	(2006.01)
A 6 1 P 11/06	(2006.01)
A 6 1 P 15/00	(2006.01)
A 6 1 P 15/10	(2006.01)
A 6 1 P 9/12	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 17/00	(2006.01)
A 6 1 P 1/04	(2006.01)
A 6 1 P 17/10	(2006.01)
A 6 1 P 1/00	(2006.01)
A 6 1 P 25/36	(2006.01)
A 6 1 P 25/32	(2006.01)
A 6 1 P 25/30	(2006.01)
C 0 7 D 413/12	(2006.01)
A 6 1 K 31/497	(2006.01)
A 6 1 K 31/433	(2006.01)
C 0 7 D 413/04	(2006.01)
A 6 1 K 31/4439	(2006.01)
C 0 7 D 413/14	(2006.01)
C 0 7 D 417/14	(2006.01)
C 0 7 D 403/04	(2006.01)
A 6 1 K 31/506	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 285/12	F
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 P 25/28	

A 6 1 P 25/18  
A 6 1 P 25/24  
A 6 1 P 25/00  
A 6 1 P 25/16  
A 6 1 P 25/14  
A 6 1 P 21/00  
A 6 1 P 25/08  
A 6 1 P 25/04  
A 6 1 P 25/06  
A 6 1 P 25/20  
A 6 1 P 9/06  
A 6 1 P 9/10  
A 6 1 P 1/12  
A 6 1 P 11/06  
A 6 1 P 15/00  
A 6 1 P 15/10  
A 6 1 P 9/12  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 17/00  
A 6 1 P 1/04  
A 6 1 P 17/10  
A 6 1 P 1/00  
A 6 1 P 25/36  
A 6 1 P 25/32  
A 6 1 P 25/30  
C 0 7 D 413/12 C S P  
A 6 1 K 31/497  
A 6 1 K 31/433  
C 0 7 D 413/04  
A 6 1 K 31/4439  
C 0 7 D 413/14  
C 0 7 D 417/14  
C 0 7 D 403/04  
A 6 1 K 31/506

【手続補正書】

【提出日】平成22年6月14日(2010.6.14)

【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

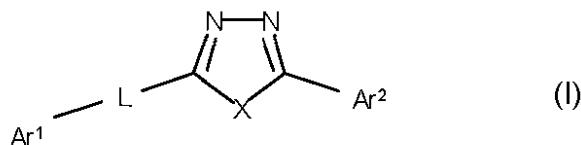
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iによって表される化合物、

【化 1】



立体異性体若しくはその立体異性体の混合物、N-オキシド、プロドラッグ、又は薬学的に許容されるその付加塩

[式中、

$\text{Ar}^1$  は、フェニル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、又はピラジニル基を表し、そのフェニル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、及びピラジニル基は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、アセトニトリル、アミノ-カルボニル（カルバモイル）、及びメチレンジオキシからなる群から選択される置換基で1回又は複数回場合により置換されていてよく、

$\text{Ar}^2$  は、アルキル・カルボニル・アミノ(アセトアミド)、又はフェニル、フラニル、チエニル、イソキサゾリル、チアゾリル若しくはピリジニル基を表し、そのフェニル、フラニル、チエニル、イソキサゾリル、チアゾリル、及びピリジニル基は、アルキル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、及びシアノからなる群から選択される置換基で1回又は複数回場合により置換されていてよく、

Lは、不在（即ち、单一共有結合を表す）であっても存在していてもよく、存在する場合、 $\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、S、 $\text{S}-\text{CH}_2$ 、O、 $\text{O}-\text{CH}_2$ 、 $\text{SO}_2$ 、及び $\text{SO}_2\text{CH}_2$ から選択される連結基を表し、

×は、○若しくはSを表す]。

## 【請求項2】

Ar<sup>1</sup>が、フェニル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、又はピラジニル基を表し、そのフェニル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、及びピラジニル基は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、アセトニトリル、アミノ-カルボニル(カルバモイル)、及びメチレンジオキシからなる群から選択される置換基で1回又は複数回場合により置換されていてよい、請求項1に記載の化合物、立体異性体若しくはその立体異性体の混合物、又は薬学的に許容されるその付加塩。

### 【請求項3】

Ar<sup>2</sup>が、アルキル-カルボニル-アミノ(アセトアミド)、又はフェニル、フラニル、チエニル、イソキサゾリル、チアゾリル若しくはピリジニル基を表し、そのフェニル、フラニル、チエニル、イソキサゾリル、チアゾリル、及びピリジニル基は、アルキル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、及びシアノからなる群から選択される置換基で1回又は複数回場合により置換されていてよい、請求項1に記載の化合物、立体異性体若しくはその立体異性体の混合物、又は薬学的に許容されるその付加塩。

## 【請求項4】

「—」が、不在（即ち、单一共有結合を表す）であっても存在していてもよく、存在する場合、 $\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、S、 $\text{S}-\text{CH}_2$ 、O、 $\text{O}-\text{CH}_2$ 、 $\text{SO}_2$ 、及び $\text{SO}_2\text{CH}_2$ から選択される連結基を表す、請求項1に記載の化合物、立体異性体若しくはその立体異性体の混合物、又は薬学的に許容されるその付加塩。

### 【請求項5】

X が、O 若しくは S を表す、請求項 1 に記載の化合物、立体異性体若しくはその立体異性体の混合物、又は薬学的に許容されるその付加塩。

## 【請求項6】

Ar<sup>1</sup>が、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロ、ニトロ、シアノ、アセトニトリル、及びアミノ-カルボニル（カルバモイル）からなる群から選択される置換基で1回又

は複数回場合により置換されているフェニルを表し、

$Ar^2$  が、アルキル、ハロ、トリフルオロメチル、及び／又はシアノで、1回若しくは2回置換されているアセトアミド、フェニル、イソキサゾリル、又はピリジニルを表す、請求項1に記載の化合物、立体異性体若しくはその立体異性体の混合物、又は薬学的に許容されるその付加塩。

【請求項7】

$Ar^1$  が、ピリジニル基を表し、

$Ar^2$  が、フェニル、フラニル、チエニル、又はピリジニルを表し、そのフェニル、フラニル、チエニル、及びピリジニル基は、アルキル、ニトロ、及び／又はシアノで、1回若しくは2回、場合により置換されている、請求項1に記載の化合物、立体異性体若しくはその立体異性体の混合物、又は薬学的に許容されるその付加塩。

【請求項8】

$Ar^1$  が、ハロで場合により置換されているピリダジニル基を表し、

$Ar^2$  が、フラニル基を表す、請求項1に記載の化合物、立体異性体若しくはその立体異性体の混合物、又は薬学的に許容されるその付加塩。

【請求項9】

$Ar^1$  が、ピラジニル基を表し、

$Ar^2$  が、フラニル基を表す、請求項1に記載の化合物、立体異性体若しくはその立体異性体の混合物、又は薬学的に許容されるその付加塩。

【請求項10】

以下の請求項1に記載の化合物、

2 - (5 - フラン - 2 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イルスルファニル) - ピラジン；

3 - (5 - ベンジルスルファニル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン；

3 - クロロ - 6 - (5 - フラン - 2 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イルスルファニル) - ピリダジン；

N - (5 - フェニルメタンスルホニル - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イル) - アセトアミド；

3 - [5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル] - ピリジン；

3 - [5 - (3 - ニトロ - フェニル) - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル] - ピリジン；

3 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル；

5 - [5 - (3 - シアノ - フェニル) - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル] - ベンゾニトリル；

5 - [5 - (3 - シアノ - フェニル) - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イル] - ベンゾニトリル；

5 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン；

3 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル；

5 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - チオフェン - 2 - カルボニトリル；

2 - メチル - 4 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル；

2 - メチル - 5 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル；

[3 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - フ

エニル] - アセトニトリル；

5 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イル) - チオフェン - 2 - カルボニトリル；

4 - クロロ - 2 - [5 - (2 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - フェニル) - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル] - フェノール；

4 - クロロ - 2 - [5 - (2 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - フェニル) - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イル] - フェノール；

3 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾアミド；

2 - (5 - クロロ - 2, 4 - ジメトキシ - フェニル) - 5 - (5 - メチル - イソオキサゾール - 3 - イル) - [1, 3, 4] オキサジアゾール；

3 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル；

3 - (5 - {6 - クロロ - ピリジン - 3 - イル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル；

(3 - [5 - {6 - クロロ - ピリジン - 3 - イル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル] - フェニル) - アセトニトリル；

3 - (5 - {6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル；

(3 - {5 - [6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル] - フェニル) - アセトニトリル；

3 - (5 - ベンゾ[1, 3]ジオキソール - 5 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン；

3 - (5 - [5 - ニトロ - チオフェン - 2 - イル] - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン；

3 - (5 - {5 - ニトロ - チオフェン - 2 - イル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン；

3 - (5 - {5 - ブロモ - フラン - 2 - イル} - [1, 3, 4] - オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン；

3 - (5 - {フラン - 2 - イル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン；

3 - (5 - イソオキサゾール - 5 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン；

3 - (5 - {2 - ブロモ - チアゾール - 4 - イル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン；

3 - (5 - フラン - 3 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン；

5 - (5 - {5 - ブロモ - チオフェン - 2 - イル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - 2 - クロロ - ピリジン；

5 - (5 - {5 - ブロモ - チオフェン - 2 - イル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - 2 - フルオロ - ピリジン；

4 - (5 - {2, 6 - ジフルオロ - ピリジン - 3 - イル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル；

4 - (5 - {2, 5, 6 - トリフルオロ - ピリジン - 2 - イル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル；

3 - (5 - {2, 6 - ジフルオロ - ピリジン - 3 - イル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル；

3 - (5 - {1, 5, 6 - トリフルオロ - ピリジン - 3 - イル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル；

3 - (5 - {4 - クロロ - フェニル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル)

- 2 , 6 - ジフルオロ - ピリジン ;  
3 - ( 5 - { 4 - クロロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル )  
- 2 , 5 , 6 - トリフルオロ - ピリジン ;  
3 - ( 5 - { 5 - ブロモ - チオフェン - 2 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール  
- 2 - イル ) - 2 - フルオロ - ピリジン ;  
3 - ( 5 - { 2 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール  
- 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
2 , 3 , 6 - トリフルオロ - 5 - ( 5 - { 3 - フルオロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ]  
オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
2 , 5 - ジフルオロ - 3 - ( 5 - { 3 - フルオロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサ  
ジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
3 - ( 5 - { 4 - クロロフェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) -  
2 , 5 , ジフルオロピリジン ;  
4 - ( 5 - { 2 , 5 - ジフルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジア  
ゾール - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
2 - ( 3 - ブロモ - 4 - メチル - フェニル ) - 5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - [ 1 ,  
3 , 4 ] オキサジアゾール ;  
4 - ( 5 - { 3 - ブロモ - 4 - メチル - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール  
- 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
2 - ( 3 - ブロモ - 4 - メチル - フェニル ) - 5 - ( 3 - フルオロ - フェニル ) - [ 1  
, 3 , 4 ] オキサジアゾール ;  
3 - ( 5 - { 3 - ブロモ - 4 - メチル - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール  
- 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
4 - ( 5 - { 2 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール  
- 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
2 - フルオロ - 3 - ( 5 - { 3 - フルオロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] - オキサジ  
アゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
3 - ( 5 - { 4 - クロロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル )  
- 2 - フルオロ - ピリジン ;  
4 - ( 5 - { 6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] - 2 - イル ) - ベ  
ンゾニトリル ;  
5 - ( 5 - { 4 - クロロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル )  
- 2 - フルオロ - ピリジン ;  
2 - フルオロ - 5 - ( 5 - { 3 - フルオロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾ  
ール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
( 3 - { 5 - [ 2 , 5 , 6 - トリフルオロ - ピリジン - 3 - イル ] - [ 1 , 3 , 4 ] オ  
キサジアゾール - 2 - イル } - フェニル ) - アセトニトリル ;  
2 - ( 2 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソオキサゾール - 5 - イル - [ 1 , 3 , 4 ]  
オキサジアゾール ;  
3 - ( 5 - { 6 - メチル - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール -  
2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
3 - ( 5 - ピリミジン - 5 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ベ  
ンゾニトリル ;  
5 - ( 5 - { 3 - フルオロフェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル )  
- ピリミジン ;  
3 - ( 5 - { 2 , 3 - ジヒドロベンゾ - [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル - [ 1 , 3 ,  
4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
3 - ( 5 - イソオキサゾール - 5 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル  
) - ベンゾニトリル ; 又は  
2 - フルオロ - 3 - ( 5 - フラン - 3 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 -

イル) - ピリジン;

立体異性体若しくはその立体異性体の混合物、又は薬学的に許容されるその付加塩。

【請求項 1 1】

少なくとも 1 種の薬学的に許容される担体若しくは希釈剤とともに、治療有効量の請求項 1 から 10 までのいずれか一項に記載の化合物、又は薬学的に許容されるその付加塩を含む医薬組成物。

【請求項 1 2】

医薬として使用するための、請求項 1 から 10 までのいずれか一項に記載の化合物、若しくは薬学的に許容されるその付加塩又はそのプロドラッグ。

【請求項 1 3】

請求項 1 から 10 までのいずれか一項に記載の化合物、若しくは薬学的に許容されるその付加塩を含む、ヒトを含む哺乳類の、コリン作動性受容体の調節に反応する疾患、障害、若しくは症状の治療、予防、又は緩和のための医薬組成物又は医薬。

【請求項 1 4】

疾患、障害、若しくは症状が認知障害、学習障害、記憶の欠如及び記憶障害、ダウントン症候群、アルツハイマー病、注意障害、注意欠陥多動性障害 (A D H D )、トウレット症候群、精神病、うつ病、双極性障害、躁病、躁うつ病、統合失調症、統合失調症に関係する認知若しくは注意障害、強迫性障害 (O C D )、パニック障害、神経性食欲不振症、過食症及び肥満等の摂食障害、ナルコレプシー、侵害受容、A I D S 認知症、老年性認知症、自閉症、パーキンソン病、ハンチントン病、筋萎縮性側索硬化症 (A L S )、不安神経症、非 O C D 不安障害、けいれん性疾患、けいれん、てんかん、神経変性障害、一過性無酸素症、誘発性神経変性症、ニューロパシー、糖尿病性ニューロパシー、末梢失調症、遅発性ジスキネジア、運動過剰症、疼痛、軽度、中等度若しくは重度の疼痛、急性、慢性若しくは反復性の疼痛、片頭痛に起因する疼痛、術後疼痛、幻肢痛、炎症性疼痛、ニューロパシー疼痛、慢性頭痛、中心性疼痛、糖尿病性ニューロパシーに関係する、治療後神経痛に関係する、若しくは末梢神経損傷に関係する疼痛、過食症、外傷後症候群、対人恐怖症、睡眠障害、偽認知症、ガンサー症候群、月経前症候群、遅発性黄体期症候群、慢性疲労症候群、無言症、抜毛癖、時差ぼけ、不整脈、平滑筋収縮、狭心症、早産、下痢、喘息、遅発性ジスキネジア、運動過剰症、早漏、勃起困難、高血圧症、炎症性疾患、炎症性皮膚疾患、にきび、酒さ、クローン病、炎症性腸疾患、潰瘍性大腸炎、下痢、又は、タバコ等のニコチン含有製品、ヘロイン、コカイン及びモルヒネ等のオピオイド、カナabis、ベンゾジアゼピン及びベンゾジアゼピン様薬物並びにアルコールを含む常習性薬物の乱用傾向及び使用停止に起因する離脱症状である請求項 1 3 に記載の医薬組成物又は医薬。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

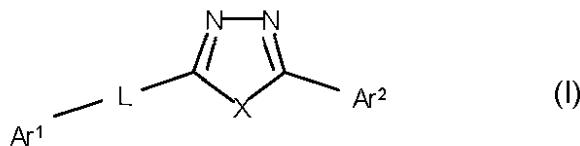
【補正対象項目名】0 0 0 9

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 0 9】

第 1 の態様において、本発明は、式 I のオキサジアゾール又はチアジアゾール誘導体、  
【化 1】



その任意の異性体若しくはその異性体の任意の混合物、N - オキシド、プロドラッグ、又は薬学的に許容されるその付加塩を提供する

[式中、

$Ar^1$  は、フェニル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、又はピラジニル基を表し、そのフェニル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、及びピラジニル基は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、アセトニトリル、アミノ・カルボニル（カルバモイル）、及びメチレンジオキシからなる群から選択される置換基で1回又は複数回場合により置換されてよく、

$Ar^2$  は、アルキル・カルボニル・アミノ（アセトアミド）、又はフェニル、フラニル、チエニル、イソオキサゾリル、チアゾリル若しくはピリジニル基を表し、そのフェニル、フラニル、チエニル、イソオキサゾリル、チアゾリル、及びピリジニル基は、アルキル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、及びシアノからなる群から選択される置換基で1回又は複数回場合により置換されてよく、

$L$  は、不在（即ち、单一共有結合を表す）であっても存在していてもよく、存在する場合、 $CH_2$ 、 $CH_2CH_2$ 、S、 $S-CH_2$ 、O、 $O-CH_2$ 、 $SO_2$ 、及び $SO_2CH_2$ から選択される連結基を表し、

$X$  は、O又はSを表す]。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0014

【補正方法】変更

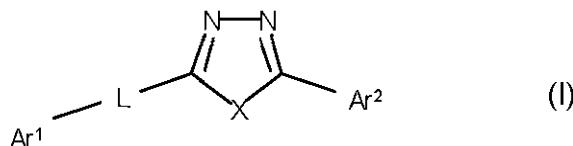
【補正の内容】

【0014】

オキサジアゾール誘導体

第1の態様において、本発明は、式Iのオキサジアゾール又はチアジアゾール誘導体、

【化2】



その任意の異性体、若しくはその異性体の任意の混合物、N-オキシド、プロドラッグ、又は薬学的に許容されるその付加塩を提供する

[式中、

$Ar^1$  は、フェニル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、又はピラジニル基を表し、そのフェニル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニル、及びピラジニル基は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、シアノ、アセトニトリル、アミノ・カルボニル（カルバモイル）、及びメチレンジオキシからなる群から選択される置換基で1回又は複数回場合により置換されていてよく、

$Ar^2$  は、アルキル・カルボニル・アミノ（アセトアミド）、又はフェニル、フラニル、チエニル、イソオキサゾリル、チアゾリル若しくはピリジニル基を表し、そのフェニル、フラニル、チエニル、イソオキサゾリル、チアゾリル、及びピリジニル基は、アルキル、ハロ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ニトロ、及びシアノからなる群から選択される置換基で1回又は複数回任意に置換されていてよく、

$L$  は、不在（即ち、单一共有結合を表す）であっても存在していてもよく、存在する場合、 $CH_2$ 、 $CH_2CH_2$ 、S、 $S-CH_2$ 、O、 $O-CH_2$ 、 $SO_2$ 、及び $SO_2CH_2$ から選択される連結基を表し、

$X$  は、O又はSを表す]が、

ただし、その化合物は以下のものではない

N-(5-ベンジルスルファニル-[1,3,4]チアジアゾール-2-イル)-アセトアミド、

3 - ( 5 - ( 5 - ニトロ - フラン - 2 - イル ) - [ 1 , 2 , 4 ] オキサジアゾール - 3 - イル ) - ピリジン、

3 - ( 5 - ( 3 - ニトロ - フェニル ) - [ 1 , 2 , 4 ] オキサジアゾール - 3 - イル ) - ピリジン、及び

2 - アセトアミド - 5 - ベンジルチオ - [ 1 , 3 , 4 ] チアジアゾール ] 。

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0063

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0063】

第3の好ましい実施形態において、本発明の化合物は式Iによって表され、式中、Lは、不在（即ち、单一共有結合を表す）であっても存在していてもよく、存在する場合、CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>、S、S-CH<sub>2</sub>、O、O-CH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>、及びSO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>から選択される連結基を表す。

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0064

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0064】

より好ましい実施形態において、Lは、不在（即ち、单一共有結合を表す）である。

【手続補正6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0065

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0065】

別のより好ましい実施形態において、Lは、存在し、CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>、S、S-CH<sub>2</sub>、O、O-CH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>、及びSO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>から選択される連結基を表す。

【手続補正7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0066

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0066】

さらにより好ましい実施形態において、Lは、存在し、S、S-CH<sub>2</sub>、及びSO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>から選択される連結基を表す。

【手続補正8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0067

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0067】

さらにもっと好ましい実施形態において、Lは、Sを表す。

【手続補正9】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0068

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【0068】

さらにより好ましい実施形態において、Lは、S - CH<sub>2</sub>を表す。

## 【手続補正10】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0069

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【0069】

さらにより好ましい実施形態において、Lは、SO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>を表す。

## 【手続補正11】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0085

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【0085】

最も好ましい実施形態において、本発明の化合物は以下の通りであり、

2 - (5 - フラン - 2 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イルスルファニル) - ピラジン；

3 - (5 - ベンジルスルファニル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン；

3 - クロロ - 6 - (5 - フラン - 2 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イルスルファニル) - ピリダジン；

N - (5 - フェニルメタンスルホニル - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イル) - アセトアミド；

3 - [5 - (5 - ニトロ - フラン - 2 - イル) - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル] - ピリジン；

3 - [5 - (3 - ニトロ - フェニル) - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル] - ピリジン；

3 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル；

5 - [5 - (3 - シアノ - フェニル) - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル] - ベンゾニトリル；

5 - [5 - (3 - シアノ - フェニル) - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イル] - ベンゾニトリル；

5 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン；

3 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル；

5 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - チオフェン - 2 - カルボニトリル；

2 - メチル - 4 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル；

2 - メチル - 5 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル；

[3 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - フェニル] - アセトニトリル；

5 - (5 - ピリジン - 3 - イル - [1, 3, 4] チアジアゾール - 2 - イル) - チオフェン - 2 - カルボニトリル；

4 - クロロ - 2 - [5 - (2 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - フェニル) - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル] - フェノール；

4 - クロロ - 2 - [ 5 - ( 2 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - フェニル ) - [ 1 , 3 , 4 ] チアジアゾール - 2 - イル ] - フェノール ;  
3 - ( 5 - ピリジン - 3 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ベンズアミド ;  
2 - ( 5 - クロロ - 2 , 4 - ジメトキシ - フェニル ) - 5 - ( 5 - メチル - イソオキサゾール - 3 - イル ) - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール ;  
3 - ( 5 - ピリジン - 3 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
3 - ( 5 - { 6 - クロロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
( 3 - [ 5 - { 6 - クロロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ] - フェニル ) - アセトニトリル ;  
3 - ( 5 - { 6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
( 3 - { 5 - [ 6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル ] - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル } - フェニル ) - アセトニトリル ;  
3 - ( 5 - ベンゾ [ 1 , 3 ] ジオキソール - 5 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
3 - ( 5 - [ 5 - ニトロ - チオフェン - 2 - イル ] - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
3 - ( 5 - { 5 - ニトロ - チオフェン - 2 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
3 - ( 5 - { 5 - ブロモ - フラン - 2 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] - オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
3 - ( 5 - { フラン - 2 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
3 - ( 5 - イソオキサゾール - 5 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
3 - ( 5 - { 2 - ブロモ - チアゾール - 4 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
3 - ( 5 - フラン - 3 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
5 - ( 5 - { 5 - ブロモ - チオフェン - 2 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - 2 - クロロ - ピリジン ;  
5 - ( 5 - { 5 - ブロモ - チオフェン - 2 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - 2 - フルオロ - ピリジン ;  
4 - ( 5 - { 2 , 6 - ジフルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
4 - ( 5 - { 2 , 5 , 6 - トリフルオロ - ピリジン - 2 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
3 - ( 5 - { 2 , 6 - ジフルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
3 - ( 5 - { 1 , 5 , 6 - トリフルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
3 - ( 5 - { 4 - クロロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - 2 , 6 - ジフルオロ - ピリジン ;  
3 - ( 5 - { 4 - クロロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - 2 , 5 , 6 - トリフルオロ - ピリジン ;  
3 - ( 5 - { 5 - ブロモ - チオフェン - 2 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - 2 - フルオロ - ピリジン ;

3 - ( 5 - { 2 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール  
 - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
 2 , 3 , 6 - トリフルオロ - 5 - ( 5 - { 3 - フルオロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ]  
 オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
 2 , 5 - ジフルオロ - 3 - ( 5 - { 3 - フルオロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサ  
 ジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
 3 - ( 5 - { 4 - クロロフェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) -  
 2 , 5 , ジフルオロピリジン ;  
 4 - ( 5 - { 2 , 5 - ジフルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジア  
 ゾール - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
 2 - ( 3 - ブロモ - 4 - メチル - フェニル ) - 5 - ( 4 - クロロ - フェニル ) - [ 1 ,  
 3 , 4 ] オキサジアゾール ;  
 4 - ( 5 - { 3 - ブロモ - 4 - メチル - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール  
 - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
 2 - ( 3 - ブロモ - 4 - メチル - フェニル ) - 5 - ( 3 - フルオロ - フェニル ) - [ 1  
 , 3 , 4 ] オキサジアゾール ;  
 3 - ( 5 - { 3 - ブロモ - 4 - メチル - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール  
 - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
 4 - ( 5 - { 2 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール  
 - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
 2 - フルオロ - 3 - ( 5 - { 3 - フルオロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] - オキサジア  
 ゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
 3 - ( 5 - { 4 - クロロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル )  
 - 2 - フルオロ - ピリジン ;  
 4 - ( 5 - { 6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] - 2 - イル ) - ベ  
 ソニトリル ;  
 5 - ( 5 - { 4 - クロロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル )  
 - 2 - フルオロ - ピリジン ;  
 2 - フルオロ - 5 - ( 5 - { 3 - フルオロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾ  
 ゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
 ( 3 - { 5 - [ 2 , 5 , 6 - トリフルオロ - ピリジン - 3 - イル ] - [ 1 , 3 , 4 ] オ  
 キサジアゾール - 2 - イル } - フェニル ) - アセトニトリル ;  
 2 - ( 2 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソオキサゾール - 5 - イル - [ 1 , 3 , 4 ]  
 オキサジアゾール ;  
 3 - ( 5 - { 6 - メチル - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール  
 - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ;  
 3 - ( 5 - ピリミジン - 5 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ベ  
 ソニトリル ;  
 5 - ( 5 - { 3 - フルオロフェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル )  
 - ピリミジン ;  
 3 - ( 5 - { 2 , 3 - ジヒドロベンゾ - [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル - [ 1 , 3 ,  
 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ;  
 3 - ( 5 - イソオキサゾール - 5 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル  
 ) - ベンゾニトリル ; 又は  
 2 - フルオロ - 3 - ( 5 - フラン - 3 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 -  
 イル ) - ピリジン ;

その任意の異性体、若しくは異性体の任意の混合物、若しくはその薬学的に許容される付加塩である。

【手続補正 1 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0094

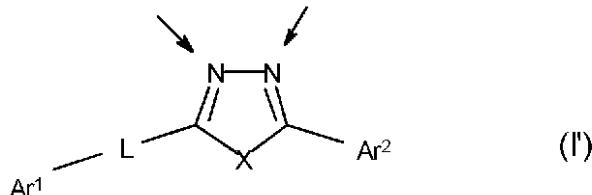
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0094】

本発明の文脈において、N-を含む化合物の「オニウム塩」も、薬学的に許容される塩として企図することができる。好ましい「オニウム塩」はアルキル-オニウム塩、シクロアルキル-オニウム塩、及びシクロアルキルアルキル-オニウム塩を含む。本発明の特に好ましいオニウム塩は、以下の式I'によるN-位置で生成されたオニウム塩を含む。\_\_\_\_\_

【化3】



【手続補正13】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0151

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0151】

これと同様に、以下の化合物を作製した。

3-(5-{5-ニトロ-フラン-2-イル}-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イル)-ピリジン(化合物7.2)  
Mp. 165~168;

3-(5-{3-ニトロ-フェニル}-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イル)-ピリジン(化合物7.3)  
Mp. 178~180;

3-(5-{3-シアノ-フェニル}-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イル)-ベンゾニトリル(化合物7.4)  
Mp. 249~251;

3-(5-ピリジン-3-イル-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イル)-ピリジン(化合物7.5)  
Mp. 181~186;

3-(5-ピリジン-3-イル-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イル)-チオフェン-2-カルボニトリル(化合物7.6)  
Mp. 218~234;

2-メチル-4-(5-ピリジン-3-イル-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イル)-ベンゾニトリル(化合物7.7)  
Mp. 231~244;

2-メチル-5-(5-ピリジン-3-イル-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イル)-ベンゾニトリル(化合物7.8)  
Mp. 152~167;

(3-{5-ピリジン-3-イル-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イル}-フェニル)-アセトニトリル(化合物7.9)  
Mp. 231~238;

3-(5-ピリジン-3-イル-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イル)-チオフェン-2-カルボニトリル(化合物7.10)

Mp . 237 ~ 241 ;  
 4 - クロロ - 2 - ( 5 - { 2 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - フェニル } [ 1 , 3 ,  
 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - フェノール ( 化合物 7 . 11 )  
 Mp . 113 ~ 119 ;  
 3 - ( 5 - ピリジン - 3 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) ベンズア  
 ミド ( 化合物 7 . 12 )  
 Mp . 233 ~ 239 ;  
 2 - ( 5 - クロロ - 2 , 4 -ジメトキシ - フェニル ) - 5 - ( 5 - メチル - イソオキサゾ  
 ル - 3 - イル ) - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール ( 化合物 7 . 13 )  
 Mp . 201 ~ 205 ;  
 3 - ( 5 - ピリジン - 3 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ベンゾ  
 ニトリル ( 化合物 7 . 14 )  
 Mp . 229 ~ 238 ;  
 3 - ( 5 - { 6 - クロロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2  
 - イル ) - ベンゾニトリル ( 化合物 7 . 15 )  
 Mp . 207 ~ 209 ;  
 ( 3 - [ 5 - { 6 - クロロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール -  
 2 - イル ] - フェニル ) - アセトニトリル ( 化合物 7 . 16 )  
 Mp . 175 ~ 180 ;  
 3 - ( 5 - { 6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール -  
 2 - イル ) - ベンゾニトリル ( 化合物 7 . 17 )  
 Mp . 198 ~ 207 ;  
 ( 3 - { 5 - [ 6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル ] - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール  
 - 2 - イル } - フェニル ) - アセトニトリル ( 化合物 7 . 18 )  
 Mp . 141 ~ 143 ;  
 3 - ( 5 - ベンゾ [ 1 , 3 ] ジオキソール - 5 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール  
 - 2 - イル ) - ピリジン ( 化合物 7 . 19 )  
 LC - ESI - HRMS [ M + H ] + : 268 . 0713 Da . 計算値 268 . 0  
 72217 Da , ずれ - 3 . 4 ppm ;  
 3 - ( 5 - [ 5 - ニトロ - チオフェン - 2 - イル ] - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール -  
 2 - イル ) - ピリジン ( 化合物 7 . 20 )  
 LC - ESI - HRMS [ M + H ] + : 275 . 0242 Da . 計算値 275 . 0  
 23887 Da , ずれ 1 . 1 ppm ;  
 3 - ( 5 - { 5 - ニトロ - チオフェン - 2 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール -  
 2 - イル ) - ピリジン ( 化合物 7 . 21 )  
 LC - ESI - HRMS [ M + H ] + : 248 . 0218 Da . 計算値 248 . 0  
 2268 Da , ずれ - 3 . 5 ppm ;  
 3 - ( 5 - { 5 - ブロモ - フラン - 2 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] - オキサジアゾール - 2  
 - イル ) - ピリジン ( 化合物 7 . 22 )  
 LC - ESI - HRMS [ M + H ] + : 291 . 9715 Da . 計算値 291 . 9  
 72165 Da , ずれ - 2 . 3 ppm ;  
 3 - ( 5 - { フラン - 2 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリ  
 ジン ( 化合物 7 . 23 )  
 LC - ESI - HRMS [ M + H ] + : 214 . 0618 Da . 計算値 214 . 0  
 61652 Da , ずれ 0 . 7 ppm ;  
 3 - ( 5 - イソオキサゾール - 5 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル )  
 - ピリジン ( 化合物 7 . 24 )  
 LC - ESI - HRMS [ M + H ] + : 215 . 0564 Da . 計算値 215 . 0  
 56901 Da , ずれ - 2 . 3 ppm ;  
 3 - ( 5 - { 2 - ブロモ - チアゾール - 4 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール -

2 - イル) - ピリジン (化合物 7 . 2 5 )

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 3 0 8 . 9 4 5 5 D a . 計算値 3 0 8 . 9  
4 4 5 7 D a , ずれ 3 p p m ;

3 - ( 5 - フラン - 3 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン (化合物 7 . 2 6 )

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 2 1 4 . 0 6 2 1 D a . 計算値 2 1 4 . 0  
6 1 6 5 2 D a , ずれ 2 . 1 p p m ;

5 - ( 5 - { 5 - ブロモ - チオフェン - 2 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール -  
2 - イル) - 2 - クロロ - ピリジン (化合物 7 . 2 7 )

M p . 2 2 3 ~ 2 2 5 ;

5 - ( 5 - { 5 - ブロモ - チオフェン - 2 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール -  
2 - イル) - 2 - フルオロ - ピリジン (化合物 7 . 2 8 )

M p . 1 8 5 ~ 1 8 6 ;

4 - ( 5 - { 2 , 6 - ジフルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル (化合物 7 . 2 9 )

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 2 8 5 . 0 5 9 6 D a . 計算値 2 8 5 . 0  
5 8 7 9 2 D a , ずれ 2 . 8 p p m ;

4 - ( 5 - { 2 , 5 , 6 - トリフルオロ - ピリジン - 2 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル (化合物 7 . 3 0 )

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 3 0 3 . 0 5 0 5 D a . 計算値 3 0 3 . 0  
4 9 3 7 D a , ずれ 3 . 7 p p m ;

3 - ( 5 - { 2 , 6 - ジフルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル (化合物 7 . 3 1 )

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 2 8 5 . 0 5 7 7 D a . 計算値 2 8 5 . 0  
5 8 7 9 2 D a , ずれ - 3 . 8 p p m ;

3 - ( 5 - { 1 , 5 , 6 - トリフルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル (化合物 7 . 3 2 )

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 3 0 3 . 0 5 0 6 D a . 計算値 3 0 3 . 0  
4 9 3 7 D a , ずれ 4 . 1 p p m ;

3 - ( 5 - { 4 - クロロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル) -  
2 , 6 - ジフルオロ - ピリジン (化合物 7 . 3 3 )

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 2 9 4 . 0 2 5 8 D a . 計算値 2 9 4 . 0  
2 4 5 7 1 D a , ずれ 4 . 2 p p m ;

3 - ( 5 - { 4 - クロロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル) -  
2 , 5 , 6 - トリフルオロ - ピリジン (化合物 7 . 3 4 )

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 3 1 2 . 0 1 5 9 D a . 計算値 3 1 2 . 0  
1 5 1 4 9 D a , ずれ 2 . 4 p p m ;

3 - ( 5 - { 5 - ブロモ - チオフェン - 2 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール -  
2 - イル) - 2 - フルオロ - ピリジン (化合物 7 . 3 5 )

M p . 1 8 8 ~ 1 9 0 ;

3 - ( 5 - { 2 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール -  
2 - イル) - ベンゾニトリル (化合物 7 . 3 6 )

M p . 1 7 1 ~ 1 7 3 ;

2 , 3 , 6 - トリフルオロ - 5 - ( 5 - { 3 - フルオロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン (化合物 7 . 3 7 )

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 2 9 6 . 0 4 5 5 D a . 計算値 2 9 6 . 0  
4 4 6 9 9 D a , ずれ 2 . 7 p p m ;

2 , 5 - ジフルオロ - 3 - ( 5 - { 3 - フルオロ - フェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン (化合物 7 . 3 8 )

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 2 7 8 . 0 5 5 4 D a . 計算値 2 7 8 . 0

5 4 1 2 1 Da, ずれ 4.6 ppm;  
 3 - (5 - {4 - クロロフェニル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - 2  
 , 5, ジフルオロピリジン(化合物7.39)  
 LC - ESI - HRMS [M + H] + : 294.025 Da. 計算値 294.02  
 4 5 7 1 Da, ずれ 1.5 ppm;  
 4 - (5 - {2, 5 - ジフルオロ - ピリジン - 3 - イル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル(化合物7.40)  
 LC - ESI - HRMS [M + H] + : 285.0586 Da. 計算値 285.0  
 5 8 7 9 2 Da, ずれ - 0.7 ppm;  
 2 - (3 - ブロモ - 4 - メチル - フェニル) - 5 - (4 - クロロ - フェニル) - [1, 3, 4] オキサジアゾール(化合物7.41)  
 LC - ESI - HRMS [M + H] + : 348.9739 Da. 計算値 348.9  
 7 4 3 2 9 Da, ずれ - 1.2 ppm;  
 4 - (5 - {3 - ブロモ - 4 - メチル - フェニル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル(化合物7.42)  
 LC - ESI - HRMS [M + H] + : 340.01 Da. 計算値 340.008  
 5 5 Da, ずれ 4.3 ppm;  
 2 - (3 - ブロモ - 4 - メチル - フェニル) - 5 - (3 - フルオロ - フェニル) - [1, 3, 4] オキサジアゾール(化合物7.43)  
 LC - ESI - HRMS [M + H] + : 333.0021 Da. 計算値 333.0  
 0 3 8 7 9 Da, ずれ - 5.3 ppm;  
 3 - (5 - {3 - ブロモ - 4 - メチル - フェニル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル(化合物7.44)  
 LC - ESI - HRMS [M + H] + : 340.0068 Da. 計算値 340.0  
 0 8 5 5 Da, ずれ - 5.1 ppm;  
 4 - (5 - {2 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ベンゾニトリル(化合物7.45)  
 LC - ESI - HRMS [M + H] + : 267.0668 Da. 計算値 267.0  
 6 8 2 1 4 Da, ずれ - 5.3 ppm;  
 2 - フルオロ - 3 - (5 - {3 - フルオロ - フェニル} - [1, 3, 4] - オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン(化合物7.46)  
 LC - ESI - HRMS [M + H] + : 260.0626 Da. 計算値 260.0  
 6 3 5 4 3 Da, ずれ - 3.6 ppm;  
 3 - (5 - {4 - クロロ - フェニル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - 2 - フルオロ - ピリジン(化合物7.47)  
 LC - ESI - HRMS [M + H] + : 276.0336 Da. 計算値 276.0  
 3 3 9 9 3 Da, ずれ - 1.4 ppm;  
 4 - (5 - {6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル} - [1, 3, 4] - 2 - イル) - ベンゾニトリル(化合物7.48)  
 LC - ESI - HRMS [M + H] + : 267.0691 Da. 計算値 267.0  
 6 8 2 1 4 Da, ずれ 3.3 ppm;  
 5 - (5 - {4 - クロロ - フェニル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - 2 - フルオロ - ピリジン(化合物7.49)  
 LC - ESI - HRMS [M + H] + : 276.0352 Da. 計算値 276.0  
 3 3 9 9 3 Da, ずれ 4.4 ppm;  
 2 - フルオロ - 5 - (5 - {3 - フルオロ - フェニル} - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - イル) - ピリジン(化合物7.50)  
 LC - ESI - HRMS [M + H] + : 260.0642 Da. 計算値 260.0  
 6 3 5 4 3 Da, ずれ 2.5 ppm;  
 (3 - {5 - [2, 5, 6 - トリフルオロ - ピリジン - 3 - イル] - [1, 3, 4] オキ

サジアゾール - 2 - イル } - フェニル ) - アセトニトリル ( 化合物 7 . 5 1 )

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 3 1 7 . 0 6 4 3 D a . 計算値 3 1 7 . 0  
6 5 0 2 D a , ずれ - 2 . 3 p p m ;

2 - ( 2 - フルオロ - フェニル ) - 5 - イソオキサゾール - 5 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール ( 化合物 7 . 5 2 )

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 2 3 2 . 0 5 2 8 D a . 計算値 2 3 2 . 0  
5 2 2 3 D a , ずれ 2 . 5 p p m ;

3 - ( 5 - { 6 - メチル - ピリジン - 3 - イル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ( 化合物 7 . 5 3 )

M p . 2 2 8 ~ 2 3 4 ;

3 - ( 5 - ピリミジン - 5 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ( 化合物 7 . 5 4 )

M p . 2 6 5 ~ 2 7 2 ;

5 - ( 5 - { 3 - フルオロフェニル } - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリミジン ( 化合物 7 . 5 5 )

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 2 4 3 . 0 6 7 7 D a . 計算値 2 4 3 . 0  
6 8 2 1 4 D a , ずれ - 2 . 1 p p m ;

3 - ( 5 - { 2 , 3 - ジヒドロベンゾ - [ 1 , 4 ] ジオキシン - 6 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ( 化合物 7 . 5 6 )

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 2 8 2 . 0 8 7 3 D a . 計算値 2 8 2 . 0  
8 7 8 6 7 D a , ずれ - 2 p p m ;

3 - ( 5 - イソオキサゾール - 5 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ベンゾニトリル ( 化合物 7 . 5 7 )

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 2 3 9 . 0 5 5 6 D a . 計算値 2 3 9 . 0  
5 6 9 0 1 D a , ずれ - 5 . 4 p p m ;

及び

2 - フルオロ - 3 - ( 5 - フラン - 3 - イル - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - イル ) - ピリジン ( 化合物 7 . 5 8 ) :

L C - E S I - H R M S [ M + H ] + : 2 3 2 . 0 5 1 8 D a . 計算値 2 3 2 . 0  
5 2 2 3 D a , ずれ - 1 . 9 p p m 。