

【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21年11月5日(2009.11.5)

【公表番号】特表2009-509986(P2009-509986A)

【公表日】平成21年3月12日(2009.3.12)

【年通号数】公開・登録公報2009-010

【出願番号】特願2008-532645(P2008-532645)

【国際特許分類】

C 07 D 413/12 (2006.01)  
C 07 D 417/12 (2006.01)  
C 07 D 417/14 (2006.01)  
C 07 D 491/113 (2006.01)  
A 61 K 31/454 (2006.01)  
A 61 P 3/10 (2006.01)  
A 61 P 3/06 (2006.01)  
A 61 P 9/10 (2006.01)  
A 61 P 25/28 (2006.01)  
A 61 K 31/5377 (2006.01)  
A 61 K 31/496 (2006.01)  
A 61 K 31/427 (2006.01)  
A 61 K 31/541 (2006.01)  
A 61 K 31/4245 (2006.01)  
A 61 K 31/438 (2006.01)  
A 61 K 31/55 (2006.01)  
A 61 P 43/00 (2006.01)  
A 61 P 3/08 (2006.01)  
A 61 P 1/18 (2006.01)  
A 61 P 3/04 (2006.01)  
A 61 P 9/12 (2006.01)  
A 61 P 29/00 (2006.01)  
A 61 P 9/00 (2006.01)  
A 61 P 1/04 (2006.01)  
A 61 P 11/06 (2006.01)  
A 61 P 37/02 (2006.01)  
A 61 P 19/02 (2006.01)  
A 61 P 35/00 (2006.01)  
A 61 P 35/02 (2006.01)  
A 61 P 25/00 (2006.01)  
A 61 P 25/16 (2006.01)  
A 61 P 17/00 (2006.01)  
A 61 P 17/02 (2006.01)  
A 61 P 17/06 (2006.01)  
A 61 P 17/08 (2006.01)  
A 61 P 17/12 (2006.01)  
A 61 P 7/00 (2006.01)  
A 61 P 19/06 (2006.01)  
A 61 P 11/00 (2006.01)  
C 07 D 487/08 (2006.01)  
A 61 K 31/4995 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 D	413/12	C S P
C 0 7 D	417/12	
C 0 7 D	417/14	
C 0 7 D	491/113	
A 6 1 K	31/454	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/496	
A 6 1 K	31/427	
A 6 1 K	31/541	
A 6 1 K	31/4245	
A 6 1 K	31/438	
A 6 1 K	31/55	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	3/08	
A 6 1 P	1/18	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/10	1 0 3
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	17/08	
A 6 1 P	17/12	
A 6 1 P	7/00	
A 6 1 P	19/06	
A 6 1 P	11/00	
C 0 7 D	487/08	
A 6 1 K	31/4995	

## 【手続補正書】

【提出日】平成21年9月11日(2009.9.11)

## 【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

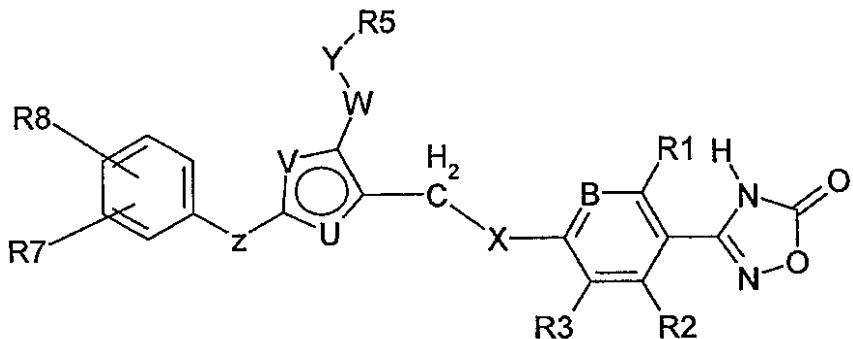
## 【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

### 式 I :

【化 1 】



式 I

の化合物、その全ての立体異性体、エナンチオマー体及びあらゆる割合での混合物、並びに生理学的に許容されるその塩及び互変異性体。

上記式中、

B は、 C ( R 4 ) 又は N であり；

R 1 は、 H、 ハロゲン、 ( C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> ) アルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - O - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>2</sub> ) アルキレン - O - ( C<sub>0</sub> - C<sub>2</sub> ) アルキレン - ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、 S C H<sub>3</sub>、 C N であり、 ここで、 アルキル及びアルキレンは、 無置換又は F で一、 二若しくは三置換され；

R 2、R 3、R 4 は、独立に、H、ハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン-O-(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン-H、SCH<sub>3</sub>、CNであり、ここで、アルキル及びアルキレンは、無置換又はFで一、二若しくは三置換され：

X は、 O、 S、 S ( O )、 S ( O )<sub>2</sub>、 O - C H<sub>2</sub>、 S - C H<sub>2</sub>、 C H<sub>2</sub> - O、 C H<sub>2</sub> - S であり：

リ及びVのうちの1つはNであり、他方はS又はOであり。

Wは、結合、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキレン、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>)アルケニレン、(C<sub>0</sub> - C<sub>6</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキレン、(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキレン - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキレンであり、ここで、アルキレン及びアルケニレン及びシクロアルキレンは、無置換又はOH及びFにより一、二若しくは三置換され：

よは、結論、 $\theta = 5^\circ$  ( $\theta = 0^\circ$ )、 $\theta = 0^\circ$  ( $\theta = 5^\circ$ )、 $N$  ( $R = 6$ ) であるとして

R 5 は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>13</sub>)シクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>14</sub>)アリール、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>)アルケニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub>)ヘテロシクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub>)ヘテロシクロアルケニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>15</sub>)ヘテロアリール、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - CO - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - CO - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>13</sub>)シクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - CO - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>)アリール、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - CO - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub>)ヘテロシクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - CO - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub>)ヘテロシクロアルケニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)

) アルキレン - CO - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロアリール、SO<sub>2</sub> - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、SO<sub>2</sub> - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>13</sub>) シクロアルキル、SO<sub>2</sub> - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリール、SO<sub>2</sub> - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロシクロアルキル、SO<sub>2</sub> - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロアリール、CO - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリール、CO - O - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、CO - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>13</sub>) シクロアルキル、CO - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロシクロアルキル、CO - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロアリール、CO - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリール、CO - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H、CO - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>13</sub>) シクロアルキル、CO - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロシクロアルキル、CO - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロアリール、SO<sub>2</sub> - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリール、SO<sub>2</sub> - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H、SO<sub>2</sub> - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>13</sub>) シクロアルキル、SO<sub>2</sub> - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロシクロアルキル、SO<sub>2</sub> - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロアリールであり、ここで、アルキル及びアルキレンは、無置換又はF、S - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、SO - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、SO<sub>2</sub> - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、CO - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub>) シクロアルキル、SO<sub>2</sub> - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリール、CO - O(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル及びO - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - Hにより一、二若しくは三置換され、そして、ここで、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルケニル及びヘテロアリールは、無置換又はF、Cl、Br、CF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル及び(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - Hにより一、二若しくは三置換され；

但し、YがS、S(O)又はS(O)<sub>2</sub>の場合、

R<sub>5</sub>は、SO<sub>2</sub> - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、SO<sub>2</sub> - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>13</sub>) シクロアルキル、SO<sub>2</sub> - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリール、SO<sub>2</sub> - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロシクロアルキル、SO<sub>2</sub> - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロアリール、SO<sub>2</sub> - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリール、SO<sub>2</sub> - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>13</sub>) シクロアルキル、SO<sub>2</sub> - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロシクロアルキル、SO<sub>2</sub> - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub>) アリール、SO<sub>2</sub> - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロシクロアルキル、SO<sub>2</sub> - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>15</sub>) ヘテロアリールではなく；

Yが、結合又はOの場合、

Zは結合ではなく；又は、

Yが結合の場合、

R 5 は、C N；F、CO - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、CO - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H、SO<sub>2</sub> - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H、N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H) - CO - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H、(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>3)シクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロシクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロシクロアルケニル、(C<sub>5</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロアリールにより、一、二若しくは三置換された(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキルであり；又は、

YがOの場合、

R 5 は、F、CO - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、CO - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>1</sub>0)アリール、CO - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>3)シクロアルキル、CO - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロシクロアルキル、CO - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロシクロアルケニル、CO - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロアリール、CO - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H、CO - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>1</sub>0)アリール、CO - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>3)シクロアルキル、CO - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロシクロアルキル、CO - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロアリール、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>3)シクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロシクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロシクロアルケニル、CO - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロアリール、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>3)シクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロシクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロシクロアルケニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロアリール、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>3)シクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>1</sub>0)アリール、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロシクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロシクロアルケニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - N((C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロアリールにより一、二若しくは三置換された(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキルであり；

R 6 は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>)アルケニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルであり、ここで、アルキル及びアルケニルは、無置換又はF及びO - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - Hにより一、二若しくは三置換され；

R 5 及び R 6 は、それらが結合している窒素原子と一緒にになり(Y = N(R<sub>6</sub>))、(C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5) - ヘテロシクロアルキル、(C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5) - ヘテロシクロアルケニル又は(C<sub>5</sub> - C<sub>1</sub>5) - ヘテロアリールを形成し、それらは更に、ヘテロ原子N、O、Sを1~3個含有することができ、その上、それらのヘテロ原子は酸化されていてもよく、そして、それらは無置換又はハロゲン、C N、CF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - H、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>6</sub> - C<sub>1</sub>0)アリール、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロシクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロシクロアルケニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub>5)ヘテロアリールにより一、二若しくは三置換された(C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>)アルキルであり；

アルキレン - O - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - ( C<sub>5</sub> - C<sub>15</sub> ) ヘテロアリール、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - S - ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - SO - ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - CO - ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - CO - ( C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub> ) アリール ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - CO - ( C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub> ) ヘテロシクロアルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - CO - ( C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub> ) ヘテロシクロアルケニル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - CO - ( C<sub>5</sub> - C<sub>15</sub> ) ヘテロアリール、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - CO - N ( ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H ) - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - CO - N ( ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H ) - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - CO - ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - CO - N ( ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H ) - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - CO - N ( ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H ) - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - ( C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub> ) アリール、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - CO - N ( ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H ) - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H ) - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - CO - ( C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub> ) ヘテロシクロアルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - CO - N ( ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H ) - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - ( C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub> ) ヘテロシクロアルケニル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - CO - N ( ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H ) - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - ( C<sub>5</sub> - C<sub>15</sub> ) ヘテロアリール、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - N ( ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H ) - CO - ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - N ( ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H ) - CO - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H ) - CO - ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - N ( ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H ) - CO - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - ( C<sub>6</sub> - C<sub>10</sub> ) アリール、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - N ( ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H ) - CO - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H ) - CO - ( C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub> ) ヘテロシクロアルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - N ( ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H ) - CO - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - ( C<sub>3</sub> - C<sub>15</sub> ) ヘテロシクロアルケニル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - ( C<sub>5</sub> - C<sub>15</sub> ) ヘテロアリールにより一、二若しくは三置換され、ここで、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル及びヘテロシクロアルケニルは、オキソ残基で一又は二置換され、そしてアルキルは、無置換又は F で一、二又は三置換されてよく；

Z は、結合、 ( C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> ) アルキレン、 ( C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> ) アルケニレン、 ( C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub> ) アルキリデン、 ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキレン - O - ( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) アルキレンであり；

R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub> は、独立に、H、ハロゲン、( C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> ) アルキル、( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - O - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H、SCF<sub>3</sub>、SF<sub>5</sub>、S(O)<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - O - ( C<sub>6</sub> - C<sub>12</sub> ) アリール、( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン ( C<sub>6</sub> - C<sub>12</sub> ) アリール、NO<sub>2</sub> から成るグループから選択され、ここで、アルキル及びアルキレンは、無置換又は F で一、二又は三置換され、そして、アリールは、無置換又はハロゲン、( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキル又は O - ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキルにより一、二若しくは三置換される。

### 【請求項 2】

R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub> は、独立に、H、ハロゲン、( C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> ) アルキル、( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - O - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H、SCH<sub>3</sub>、CN であり、ここで、アルキル及びアルキレンは、無置換又は F で一、二若しくは三置換され；

R<sub>4</sub> は、H、( C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> ) アルキル、( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - O - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H であり、ここで、アルキル及びアルキレンは、無置換又は F で一、二若しくは三置換される；

請求項 1 に記載の式 I の化合物。

### 【請求項 3】

B は、C ( R<sub>4</sub> ) であり；そして

R 4 は H である；

請求項 1 又は 2 に記載の式 I の化合物。

【請求項 4】

R 1 は、ハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>2</sub>)アルキレン - H、O - (C<sub>0</sub> - C<sub>2</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルであり、ここで、アルキル及びアルキレンは、無置換又は F で一、二若しくは三置換される；

請求項 1 ~ 3 の何れか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 5】

W は、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレンであり；

Y は、N(R<sub>6</sub>)であり；そして

R 5 及び R 6 はそれらが結合している窒素原子と一緒にになって(Y = N(R<sub>6</sub>))、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - ヘテロシクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) - ヘテロシクロアルケニル又は(C<sub>5</sub> - C<sub>8</sub>) - ヘテロアリールを形成し、それらは更に 1 ~ 2 個のヘテロ原子 N、O、S を含有することができ、そして、それらは、無置換又は F、CF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレン - H、SO<sub>2</sub> - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキル、CO - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキル、CO - NH<sub>2</sub>、NH - CO - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキル、フェニル、(C<sub>5</sub> - C<sub>6</sub>)ヘテロアリール、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>)ヘテロシクロアルキル及び(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)ヘテロシクロアルケニルにより一若しくは二置換され、ここで、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルケニル及びヘテロアリールは、オキソ残基により一若しくは二置換されても良い；

請求項 1 ~ 4 の何れか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 6】

W は、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレンであり；

Y は、N(R<sub>6</sub>)であり；そして

R 5 は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>)シクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレン - フェニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>)ヘテロシクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>)ヘテロシクロアルケニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>6</sub>)ヘテロアリール、CO - (C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>)アルキル、CO - O - フェニルであり、ここで、アルキル及びアルキレンは、F、S - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキル、SO - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキル、SO<sub>2</sub> - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキル、N((C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレン - H、CO - O(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキル及びO - (C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレン - Hにより一、二若しくは三置換されても良く、そして、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルケニル及びヘテロアリールは、F 及び(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>)アルキレン - Hにより一、二若しくは三置換され；

R 6 は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキル又は(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルであり、ここで、アルキルは、無置換又は O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - H で一、二若しくは三置換され；又は

Y は S、S(O)、S(O)<sub>2</sub> であり；そして

R 5 は、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキル又は(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキルであり、ここで、アルキルは、無置換又は F で一、二若しくは三置換され；又は

Y は、O であり；そして

R 5 は、F、CO - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>)アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>)ヘテロシクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>)アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>8</sub>)ヘテロアリールにより一、二若しくは三置換された(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルであり；又は

Z は、-CH<sub>2</sub> - 、 -CH<sub>2</sub> - CH<sub>2</sub> - 、 -CH<sub>2</sub> - O - CH<sub>2</sub> - 、 -CH = CH - である；

請求項 1 ~ 5 の何れか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 7】

V は N であり、そして U は O である；又は

V は N であり、そして U は S である；

請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 8】

X が O 又は O - C H<sub>2</sub> である請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 9】

W が結合又は - C H<sub>2</sub> - である請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 10】

R<sub>7</sub> がパラ位である請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 11】

R<sub>8</sub> が H である請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 12】

R<sub>1</sub> はハロゲン、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレン - H、O - (C<sub>0</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルであり、ここで、アルキル及びアルキレンは、無置換又は F で一、二若しくは三置換され；

W は、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレンであり；

Y は、N (R<sub>6</sub>) であり；そして

R<sub>5</sub> 及び R<sub>6</sub> は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって (Y = N (R<sub>6</sub>)) 、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - ヘテロシクロアルキル、(C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) - ヘテロシクロアルケニル、又は (C<sub>5</sub> - C<sub>8</sub>) - ヘテロアリールを形成し、それらは更に、1 ~ 2 個のヘテロ原子 N、O、S を含有することができ、そして、それらは、無置換又は F、C F<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - H、S O<sub>2</sub> - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、C O - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、C O - N H<sub>2</sub>、N H - C O - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、フェニル、(C<sub>5</sub> - C<sub>6</sub>) ヘテロアリール、(C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) ヘテロシクロアルキル及び (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) ヘテロシクロアルケニルにより一若しくは二置換され、ここで、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルケニル及びヘテロアリールは、オキソ残基で一若しくは二置換されても良く；

W は、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレンであり；

Y は、N (R<sub>6</sub>) であり；そして

R<sub>5</sub> は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) シクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - フェニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) ヘテロシクロアルキル、(C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - (C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub>) ヘテロシクロアルケニル、(C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - (C<sub>5</sub> - C<sub>6</sub>) ヘテロアリール、C O - (C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、C O - O - フェニルであり、ここで、アルキル及びアルキレンは、F、S - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、S O - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、S O<sub>2</sub> - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、N ((C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - H) - (C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - H、C O - O (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル及び O - (C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - H により一、二若しくは三置換されても良く、そして、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルケニル及びヘテロアリールは、F 及び (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H により一、二若しくは三置換され；

R<sub>6</sub> は、H、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル又は (C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルであり、ここで、アルキルは、無置換又は O - (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) - アルキレン - H で一、二若しくは三置換され；

Y は、S、S (O)、S (O)<sub>2</sub> であり；そして

R<sub>5</sub> は、(C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル又は (C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub>) アルキレン - (C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>) シクロアルキルであり、ここで、アルキルは、無置換又は F で一、二若しくは三置換され；

Y は、O であり；そして

R 5 は、 F、 C O - ( C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ) アルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub> ) アルキレン - ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub> ) アルキレン - ( C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> ) ヘテロシクロアルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>3</sub> ) アルキレン - ( C<sub>5</sub> - C<sub>8</sub> ) ヘテロアリールにより、二若しくは三置換された ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキルであり；又は

Z は、 - C H<sub>2</sub> - 、 - C H<sub>2</sub> - C H<sub>2</sub> - 、 - C H<sub>2</sub> - O - C H<sub>2</sub> - 、 - C H = C H - である；

請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 13】

B は、 C ( R 4 ) であり；そして

R 4 は、 H であり；

R 1 は、 F、 C 1、 ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - O - ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>2</sub> ) アルキレン - O - ( C<sub>0</sub> - C<sub>2</sub> ) アルキレン - ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキルであり、ここで、アルキル及びアルキレンは、無置換又は F で、一、二若しくは三置換され；

R 2 は、 H であり；

R 3 は、 H、 F、 Br であり；

R 4 は、 H であり；

X は、 O、 O - C H<sub>2</sub> であり；

U は、 S、 O であり；そして

V は、 N であり；

又は、

U は、 N であり；そして

V は、 O であり；

W は、 結合、 ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレンであり；

Y は、 N ( R 6 ) であり；そして

R 5 は、 ( C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> ) アルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - ( C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub> ) シクロアルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - ( C<sub>6</sub> - C<sub>1</sub> ) アリール、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - ( C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub> ) ヘテロシクロアルキル C O - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキル、 C O - O - ( C<sub>6</sub> - C<sub>1</sub> ) アリールから成るグループから選択され、ここで、アルキル及びアルキレンは、 S - ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキル、 S O - ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキル、 N ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H 及び O - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H により、二若しくは三置換されても良く、そして、ここで、アリール及びヘテロシクロアルキルは、 F 及び ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) - アルキレン - O - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H により、二若しくは三置換され；

Y は、 O であり；そして

R 5 は、 F、 C O - ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキルにより、二若しくは三置換された ( C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> ) アルキルであり；又は

Z は、 - C H<sub>2</sub> - 、 - C H<sub>2</sub> - C H<sub>2</sub> - 、 - C H<sub>2</sub> - O - C H<sub>2</sub> - 、 - C H = C H - であり；

Y は、 S、 S ( O ) 、 S ( O )<sub>2</sub> であり；そして

R 5 は、 ( C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ) アルキルであり；

R 6 は、 H、 ( C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> ) アルキル又は ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ) シクロアルキルであり、ここで、アルキルは、無置換又は O - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) - アルキレン - H により、二若しくは三置換され；

R 5 及び R 6 は、それらが結合している窒素原子と一緒にになって ( Y = N ( R 6 ) ) 、 ( C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> ) - ヘテロシクロアルキル、 ( C<sub>3</sub> - C<sub>1</sub> ) - ヘテロシクロアルケニルを形成することができ、それらは更に、1 ~ 3 個のヘテロ原子 N、O、S を含有することができ、そして、それらは、無置換又は F、 C F<sub>3</sub>、 ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキル、 ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - O - ( C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキレン - H、 S O<sub>2</sub> - ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) アルキル

、  $\text{CO} - (\text{C}_1 - \text{C}_4)$  アルキルにより一、二若しくは三置換され、ここで、ヘテロシクロアルキルは、オキソ残基により一若しくは二置換されても良く；

$Z$  は、結合、 $(\text{C}_1 - \text{C}_2)$  アルキレン、 $(\text{C}_2)$  アルケニレン、 $(\text{C}_1 - \text{C}_2)$  アルキレン- $\text{O} - (\text{C}_1 - \text{C}_2)$  アルキレンであり；

$R_7$  は、 $\text{H}$ 、 $\text{O} - (\text{C}_1 - \text{C}_4)$  アルキル、 $\text{CF}_3$  であり；

$R_8$  は、 $\text{H}$  である；

請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 14】

$R_1$  は、ハロゲン、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$  アルキル、 $\text{OH}$ 、 $\text{O} - (\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキルであり、ここで、アルキルは、無置換又は  $\text{F}$  で一、二若しくは三置換され；

$R_2$  は、 $\text{H}$  であり；

$R_3$  は、 $\text{H}$ 、 $\text{F}$  であり；

$B$  は、 $\text{C} (R_4)$  又は  $\text{N}$  であり；そして

$R_4$  は、 $\text{H}$  であり；

$X$  は、 $\text{O}$  であり；

$U$  及び  $V$  のうちの 1 つは  $\text{N}$  であり、他方は  $\text{S}$  又は  $\text{O}$  であり；

$W$  は、 $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキレンであり；

$Y$  は、 $\text{N} (R_6)$  であり；そして

$R_5$  及び  $R_6$  はそれらが結合している窒素原子と一緒にになって ( $Y = \text{N} (R_6)$ ) 、 ( $\text{C}_3 - \text{C}_7$ ) - ヘテロシクロアルキル、 $(\text{C}_4 - \text{C}_7)$  - ヘテロシクロアルケニル又は ( $\text{C}_5 - \text{C}_8$ ) - ヘテロアリールを形成し、それらは更に、1 ~ 2 個のヘテロ原子  $\text{N}$ 、 $\text{O}$ 、 $\text{S}$  を含むことができ、そして、それらは、無置換又は  $\text{F}$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル、 $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$  アルキレン- $\text{O} - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$  アルキレン- $\text{H}$ 、 $\text{SO}_2 - (\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル、 $\text{CO} - (\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル、 $\text{CO} - \text{NH}_2$ 、 $\text{NH} - \text{CO} - (\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル、フェニル、 $(\text{C}_5 - \text{C}_5)$  ヘテロアリール、 $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$  ヘテロシクロアルキル及び  $(\text{C}_4 - \text{C}_7)$  ヘテロシクロアルケニルにより一若しくは二置換され、ここで、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルケニル及びヘテロアリールは、オキソ残基により一若しくは二置換されても良く、

$Y$  は、 $\text{N} (R_6)$  であり；そして、

$R_5$  は、 $\text{H}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$  アルキル、 $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$  アルキレン- $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$  シクロアルキル、 $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$  アルキレン-フェニル、 $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$  アルキレン- $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$  ヘテロシクロアルキル、 $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$  アルキレン- $(\text{C}_5 - \text{C}_6)$  ヘテロアリール、 $\text{CO} - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$  アルキル、 $\text{CO} - \text{O} - \text{フェニル}$  であり、ここで、アルキル及びアルキレンは、 $\text{F}$ 、 $\text{S} - (\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル、 $\text{SO} - (\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル、 $\text{SO}_2 - (\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル、 $\text{N} ((\text{C}_0 - \text{C}_3))$  アルキレン- $\text{H}$  -  $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$  アルキレン- $\text{H}$ 、 $\text{CO} - \text{O} (\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル及び  $\text{O} - (\text{C}_0 - \text{C}_3)$  アルキレン- $\text{H}$  により一、二若しくは三置換されても良く、そして、ここで、シクロアルキル、フェニル、ヘテロシクロアルキル、ヘテロシクロアルケニル及びヘテロアリールは、 $\text{F}$  及び  $(\text{C}_0 - \text{C}_4)$  - アルキレン- $\text{O} - (\text{C}_0 - \text{C}_4)$  アルキレン- $\text{H}$  により、一、二若しくは三置換され；

$R_6$  は、 $\text{H}$ 、 $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル又は  $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$  アルキレン- $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$  シクロアルキルであり、ここで、アルキルは、無置換又は  $\text{O} - (\text{C}_0 - \text{C}_4)$  - アルキレン- $\text{H}$  により一、二若しくは三置換され；

$Y$  は、 $\text{S}$ 、 $\text{S} (\text{O})$ 、 $\text{S} (\text{O})_2$  であり；そして

$R_5$  は、 $(\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル又は  $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$  アルキレン- $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$  シクロアルキルであり、ここで、アルキルは、 $\text{F}$  で一、二若しくは三置換され；

$Y$  は、 $\text{O}$  であり；そして

$R_5$  は、 $\text{F}$ 、 $\text{CO} - (\text{C}_1 - \text{C}_3)$  アルキル、 $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$  アルキレン- $(\text{C}_3 - \text{C}_6)$  シクロアルキル、 $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$  アルキレン- $(\text{C}_3 - \text{C}_7)$  ヘテロシクロアルキル、 $(\text{C}_0 - \text{C}_3)$  アルキレン- $(\text{C}_5 - \text{C}_8)$  ヘテロアリールにより一、二若しくは三置

換された (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキルであり；又は

Z は、 - C H<sub>2</sub> - 、 - C H<sub>2</sub> - C H<sub>2</sub> - 、 - C H<sub>2</sub> - O - C H<sub>2</sub> - 、 - C H = C H - で  
あり；

Z は、 結合、 (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレン、 (C<sub>2</sub>) アルケニレン、 (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アル  
キレン - O - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) アルキレンであり；

R 7 は、 H、 ハロゲン、 (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、 O - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキルであり  
、ここでアルキルは、無置換又は F で一、二若しくは三置換され；

R 8 は H である；

請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 15】

R 1 は、 F、 O H、 O C H<sub>3</sub>、 O C H F<sub>2</sub>、 O C H<sub>2</sub> C F<sub>3</sub> であり；

R 2 は、 H であり；

R 3 は、 H、 F であり；

B は、 C (R 4) 又は N であり；そして

R 4 は、 H であり；

X は、 O であり；

U 及び V のうちの 1 つは N であり、他方は S 又は O であり；

W は、 C H<sub>2</sub>、 C H<sub>2</sub> C H<sub>2</sub> C H<sub>2</sub> であり；

Y は、 N (R 6) であり；そして

R 5 及び R 6 は、 それらが結合している窒素原子と一緒にになって (Y = N (R 6)) 、  
ピペリジン、ピロリジン、アゼチジン、アゼピン、モルホリン、チオモルホリン、チオモ  
ルホリン - S - オキシド、チオモルホリン - S - ジオキシド、ピペラジン、ピペラジノン  
、イソインドリンを形成し、それらは、無置換又は F、 C F<sub>3</sub>、 (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル  
、 O - (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) アルキル、 O H、 C H<sub>2</sub> O H、 S O<sub>2</sub> C H<sub>3</sub>、 C O C H<sub>3</sub>、 フェニ  
ルにより一、二置換され；

Y は、 S、 S (O)、 S (O)<sub>2</sub> であり；そして

R 5 は、 C H<sub>3</sub> であり；

Z は、 結合であり；

R 7 は、 C F<sub>3</sub> であり；

R 8 は、 H である；

請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 16】

R 1 は、 H、 F、 C 1 であり；

R 2 は、 H であり；

R 3 は、 H であり；

B は、 C (R 4) 又は N であり；そして

R 4 は、 H であり；

X は、 O であり；

U は、 S、 O であり；そして

V は、 N であり；

W は、 C H<sub>2</sub> であり；

Y は、 結合又は O であり；

Z は、 結合であり；

R 5 は、 F で一、二若しくは三置換された (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) アルキルであり；

R 7 は、 パラ位の、そして、 (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) アルキル、 (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - O  
- (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - H、 S F<sub>5</sub>、 (C<sub>0</sub> - C<sub>4</sub>) アルキレン - O - フェニルで  
あり、ここで、アルキル、アルキレン及びフェニルは、 F で一、二若しくは三置換され；

R 8 は H である；

請求項 1 ~ 15 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物。

【請求項 17】

請求項 1 ~ 16 の何れか 1 項に記載の式 I の化合物を 1 つ又はそれ以上含む医薬品。

【請求項 18】

請求項 1 ~ 16 の何れか 1 項に記載の式 I の化合物を 1 つ又はそれ以上、及び 1 つ又はそれ以上の抗糖尿病薬を含む医薬品。

【請求項 19】

請求項 1 ~ 16 の何れか 1 項に記載の式 I の化合物を 1 つ又はそれ以上、及び 1 つ又はそれ以上の脂質モジュレーターを含む医薬品。

【請求項 20】

請求項 1 ~ 16 の何れか 1 項に記載の式 I の化合物を含む、脂肪酸代謝障害及びグルコース利用障害の治療又は予防のための医薬。

【請求項 21】

請求項 1 ~ 16 の何れか 1 項に記載の式 I の化合物を含む、インスリン抵抗性に関係する障害の治療又は予防のための医薬。

【請求項 22】

請求項 1 ~ 16 の何れか 1 項に記載の式 I の化合物を含む、糖尿病に伴う後遺症の予防を含む糖尿病の治療又は予防のための医薬。

【請求項 23】

請求項 1 ~ 16 の何れか 1 項に記載の式 I の化合物を含む、異脂肪血症及びその後遺症の治療又は予防のための医薬。

【請求項 24】

請求項 1 ~ 16 の何れか 1 項に記載の式 I の化合物を含む、メタボリックシンドロームに関係する可能性のある状態の治療又は予防のための医薬。

【請求項 25】

請求項 1 ~ 16 の何れか 1 項に記載の式 I の化合物を含む、中枢及び末梢神経系の脱髓及び他の神経変性障害の治療又は予防のための医薬。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0056

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0056】

本明細書で使用する用語アルキニルは、炭化水素残基で、1 ~ 4 個の三重結合を有し、そして、線状、即ち、直鎖状、又は分枝鎖状であっても良い基を意味することを、最も広い意味で理解すべきである。特に指示の無い限り、定義されるアルキニルは、2 ~ 8 個の炭素原子を含む。「- (C<sub>2</sub> - C<sub>8</sub>) - アルキニル」の例は、2、3、4、5、6、7 又は 8 個の炭素原子を含むアルキニル残基であり、例えば、エチニル、1 - プロピニル、2 - プロピニル (= プロパルギル) 又は 2 - ブチニルがある。これら全ての説明は、又、用語アルキニレンにも適用される。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0153

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0153】

MC4 作動薬 ( 例えば、[ 2 - ( 3a - ベンジル - 2 - メチル - 3 - オキソ - 2 , 3 , 3a , 4 , 6 , 7 - ヘキサヒドロ - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン - 5 - イル ) - 1 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - オキソエチル ] - 1 - アミノ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - カルボキサミド ( WO 第 01 / 91752 号 ) ) 、又は LB53280 、 LB53279 、 LB53278 若しくは THIQ 、 MB243 、 RY764 、 CHIR - 785 、 PT - 141 、又は WO 第 2005060985 号、 WO 第 2005

009950号、WO第2004087159号、WO第2004078717号、WO第2004078716号、WO第2004024720号、US第20050124652号、WO第2005051391号、WO第2004112793号、US第20050222014号、US第20050176728号、US第20050164914号、US第20050124636号、US第20050130988号、US第20040167201号、WO第2004005324号、WO第2004037797号、WO第2005042516号、WO第2005040109号、WO第2005030797号、US第20040224901号、WO第200501921号、WO第200509184号、WO第2005000339号、EP1460069号、WO第2005047253号、WO第2005047251号、EP1538159号、WO第2004072076号、WO第2004072077号若しくはWO第2006024390号に記載のもの；

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0211

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0211】

一般式A-2の化合物であって、X'が-OH、-SH、-CH<sub>2</sub>OH又は-CH<sub>2</sub>SHであり、そして、R1、R2、R3、Bが上記で定義した通りである化合物は、一般式A-1の化合物であって、Rがハライド(I、Br、Cl)又はスルホナート(OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、OSO<sub>2</sub>C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>CH<sub>3</sub>)、そしてR5、R7、R8、U、V、W、Y及びZが上記で定義した通りである化合物と、炭酸セシウム又は水素化ナトリウムの様な塩基の存在下、ジメチルホルムアミドの様な溶媒中で反応し、又は一般式A-1のアルコールであって、ここで、R=OH、そしてR5、R7、R8、U、V、W、Y及びZは上記で定義した通りであるアルコールと、Mitsunobu反応条件下(例えば、トリフェニルホスフィン、アゾジカルボン酸ジエチル)で、ジクロロメタンの様な非極性の溶媒中で反応し、一般式A-4の化合物であって、X=O、S、-OCH<sub>2</sub>-又は-SCH<sub>2</sub>-の化合物を与える。この方法は、一般式A-3の化合物であって、Rがハライド(I、Br、Cl)又はスルホナート(OSO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、OSO<sub>2</sub>PhCH<sub>3</sub>)であり、そして、R5、R7、R8、U、V、W、Y及びZは上記で定義した通りである化合物に、又は一般式A-3のアルコールであって、R=OH、そして、R5、R7、R8、U、V、W、Y及びZは上記で定義した通りであるアルコールに、既述した反応条件下で適用することができ、一般式A-4であって、X=-CH<sub>2</sub>O-又は-CH<sub>2</sub>S-である化合物を生成する。一般式A-4の化合物は、ヒドロキシルアミン塩酸塩と、トリエチルアミンの様な塩基の存在下、テトラヒドロフラン及びメタノールの様な溶媒中で反応し、一般式A-5の化合物を与える。この反応を、マイクロウエーブ照射下で反応混合物を加熱することにより促進させることができる。一般式A-5の化合物を、ピリジン又はジイソプロピルエチルアミンの様な塩基の存在下で、クロロギ酸フェニルと反応させ、次いで、反応混合物をマイクロウエーブ照射で加熱して環化し、又は、代わりに、得られた中間体を単離し、そして、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エンの様な塩基と、アセトニトリルの様な溶媒中で処理することにより、一般式A-6の生成物に転換される。基質A-5においてR5がHである場合、一般式A-6であって、R5=C(=O)C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>である化合物が生成し、それは水酸化カリウムの様な水酸化物塩で加水分解され、一般式A-6であって、R5がHである生成物を与える。

実施例54～59は、方法Aに従って得られた。

他の化合物も本方法に従って、又は公知の方法で得ることができる。

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0231

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0231】

一般式 L - 1 の化合物（この化合物は方法 A により合成され、ここで、基本構造 A - 1 の置換基 W - Y - R 5 は - C H <sub>2</sub> - O P G である；この基本構造の合成は、方法 J 及び K に記載されている；B、U、V、X、R 1、R 2、R 3、R 4、R 7 及び R 8 は定義した通りであり、そして、P G は、例えば、テトラヒドロピラニルエーテルの様な保護基を意味する）の保護基は除去される。一般式 L - 1 の化合物の保護基は、P G がテトラヒドロピラニルエーテルの場合、例えば、酸による、メタノールの様な極性溶媒中での処理により脱離され、一般式 I - 2 の化合物を生成する。一般式 L - 2 の化合物のヒドロキル基は、例えば、メシラート又はクロリドに、メタンスルホニルクロリドによる、トリエチルアミンの様な塩基の存在下、ジクロロメタンの様な溶媒中での処理により脱離基（L G）に転換され、一般式 L - 3 の化合物を生成する。一般式 L - 3 の化合物は、求核剤 Y - R 5 であって、Y が O H、又は Y が N H (R 6) であり、そして R 5 が定義されたものである化合物と、テトラヒドロフランの様な極性溶媒中で、D B U の様な塩基の存在下で反応させ、一般式 L - 4 の化合物を得る。一般式 L - 4 の化合物は、ヒドロキシリルアミン塩酸塩と、トリエチルアミンの様な塩基の存在下、テトラヒドロフラン及びメタノールの様な溶媒中で反応させ、一般式 L - 5 の化合物を得る。一般式 L - 5 の化合物は、クロロギ酸フェニルと、ピリジンの様な塩基の存在下での反応、及びこの中間体を、1, 8 - ジアザビシクロ [5.4.0] ウンデカ - 7 - エンの様な塩基による、アセトニトリルの様な溶媒中での処理により、一般式 L - 6 の生成物に転換される。

実施例 60 ~ 83 は、方法 L により得られた。

他の化合物も本方法に従ってき、又は公知の方法で得ることができる。

【手続補正 6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0234

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0234】

略語のリスト：

A c : アセチル；

A I B N : 2, 2' - アゾビス (2 - メチルプロピオニトリル)；

B n : ベンジル；

i B u : イソブチル；

t B u : t e r t - ブチル；

B u L i : n - ブチルリチウム；

B z : ベンゾイル；

C I : 化学イオン化 (M S)；

C y : シクロヘキシリル；

D B U : 1, 8 - ジアザビシクロ [5.4.0] ウンデカ - 7 - エン；

D E A D : アゾジカルボン酸ジエチル；

D C I : 直接化学イオン化；

D C M : ジクロロメタン；

D M A P : N, N - ジメチルアミノピリジン；

D M F : N, N - ジメチルホルムアミド；

D M S O : ジメチルスルホオキシド；

E A : 酢酸エチル；

e q : 当量；

E I : 電子衝撃イオン化 (M S)；

E S I : 電子スプレーイオン化 (M S)；

F G : 官能基 ;  
 F - T E D A : 1 - クロロメチル - 4 - フルオロ - 1 , 4 - ジアゾニアビシクロビシクロ [ 2 . 2 . 2 ] オクタン・ビス ( テトラフルオロボラート ) ;  
 H a l : ハロゲン ;  
 H P L C : 高速液体クロマトグラフィー ;  
 L C - M S : 質量分析法を組合せた液体クロマトグラフィー ;  
 L G : 脱離基 ;  
 M e : メチル ;  
 M C P B A : メタ - クロロ過安息香酸 ;  
 M S : 質量分析法 ;  
 M s C l : メタンスルホニルクロリド ;  
 M W : マイクロウェーブ ;  
 N B S : N - プロモスクシンイミド ;  
 N M R : 核磁気共鳴 ;  
 p : パラ ;  
 P d / C : 炭素上のパラジウム ;  
 P G : 保護基 ;  
 i P r : イソプロピル ;  
 n P r : n - プロピル ;  
 p T s O H : p - トルエンスルホン酸 ;  
 R f : 保持時間 ;  
 t e r t : 第三級 ;  
 T L C : 薄層クロマトグラフィー ;  
 T M S : トリメチルシリル ;

## 【手続補正7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0262

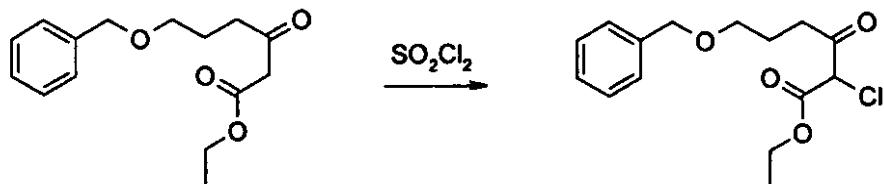
【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【0262】

6 - ベンジルオキシ - 2 - クロロ - 3 - オキソ - ヘキサン酸エチルエステル

## 【化49】



6 - ベンジルオキシ - 3 - オキソ - ヘキサン酸エチルエステル ( Paulvannan, K. ; Stille, J. R. Org. Chem., 1994, 59, 1613-1620 ) ( 1 g ) の無水ジクロロメタン ( 10 mL ) 溶液に、スルフリルクロリド ( 0.307 mL ) を、0 度で滴下しながら加えた。反応混合物を 0 度で 30 分間及び室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を水 ( 20 mL ) に注ぎ、ジクロロメタン 100 mL ずつで 2 回抽出した。集めた有機抽出物を水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮し、6 - ベンジルオキシ - 2 - クロロ - 3 - オキソ - ヘキサン酸エチルエステル ( 1.15 g ) を得、それを更に精製せずに次の工程で用いた。

## 【手続補正8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0451

【補正方法】変更

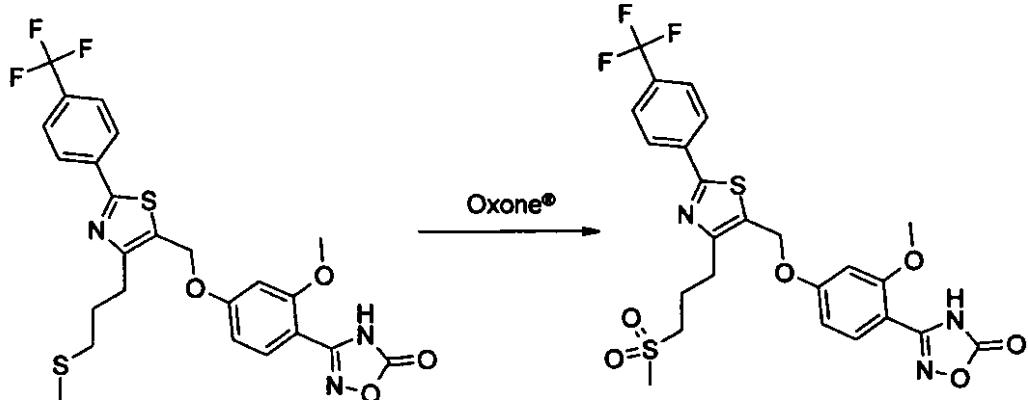
## 【補正の内容】

## 【0451】

## 〔実施例102〕

3 - { 4 - [ 4 - ( 3 - メタンスルホニル - プロピル ) - 2 - ( 4 - トリフルオロメチル - フェニル ) - チアゾール - 5 - イルメトキシ ] - 2 - メトキシ - フェニル } - 4 H - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 5 - オン

## 【化236】



3 - { 2 - メトキシ - 4 - [ 4 - ( 3 - メチルスルファニル - プロピル ) - 2 - ( 4 - トリフルオロメチル - フェニル ) - チアゾール - 5 - イルメトキシ ] - フェニル } - 4 H - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 5 - オン ( 60 mg ) のアセトニトリル ( 2 mL ) 及び水 ( 0.5 mL ) 中の懸濁液に、Oxone ( 登録商標 ) ( 過硫酸モノカリウム ) ( 230 mg ) を加えた。混合物を室温で 3 時間攪拌し、その後、酢酸エチル / 水に注いだ。有機抽出物を分離し、飽和の  $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$  水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過し、減圧下で濃縮した。残留物をアセトニトリル ( 1 mL ) で粉碎し、濾過して、3 - { 4 - [ 4 - ( 3 - メタンスルホニル - プロピル ) - 2 - ( 4 - トリフルオロメチル - フェニル ) - チアゾール - 5 - イルメトキシ ] - 2 - メトキシ - フェニル } - 4 H - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 5 - オン ( 16 mg ) をベージュ色の固体として得た。

C<sub>24</sub>H<sub>22</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>S<sub>2</sub> ( 569.58 ) , MS ( ESI ) : 570 ( M + H<sup>+</sup> )

。