(19)日本国特許庁(JP)　(12)特　許　公　報(B2)　(11)特許番号

特許第6815566号
(P6815566)

(45)発行日　令和3年1月20日(2021.1.20)　(24)登録日　令和2年12月24日(2020.12.24)

(51)Int.Cl.		F I		
A61K 31/4995	(2006.01)	A61K	31/4995	
A61K 31/5386	(2006.01)	A61K	31/5386	
A61P 29/00	(2006.01)	A61P	29/00	
A61P 43/00	(2006.01)	A61P	43/00	105
A61P 35/00	(2006.01)	A61P	35/00	

請求項の数 7　(全 413 頁)　最終頁に続く

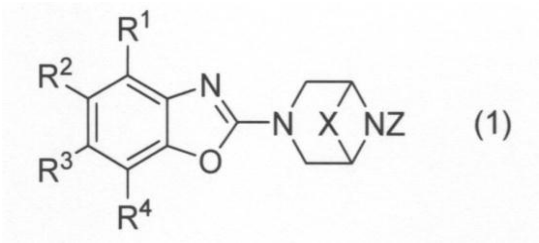
(21)出願番号　特願2020-527615 (P2020-527615)
(86)(22)出願日　令和1年6月27日(2019.6.27)
(86)国際出願番号　PCT/JP2019/025526
(87)国際公開番号　WO2020/004521
(87)国際公開日　令和2年1月2日(2020.1.2)
審査請求日　令和2年10月6日(2020.10.6)
(31)優先権主張番号　特願2018-121442 (P2018-121442)
(32)優先日　平成30年6月27日(2018.6.27)
(33)優先権主張国・地域又は機関
日本国(JP)

早期審査対象出願

(73)特許権者　000006091
Ｍｅｉｊｉ　Ｓｅｉｋａファルマ株式会社
東京都中央区京橋２丁目４番１６号
(74)代理人　110001047
特許業務法人セントクレスト国際特許事務所
(72)発明者　石田　那月
神奈川県横浜市港北区師岡町７６０　Ｍｅｉｊｉ　Ｓｅｉｋａファルマ株式会社内
(72)発明者　田端　祐二
神奈川県横浜市港北区師岡町７６０　Ｍｅｉｊｉ　Ｓｅｉｋａファルマ株式会社内
(72)発明者　松平　崇
神奈川県横浜市港北区師岡町７６０　Ｍｅｉｊｉ　Ｓｅｉｋａファルマ株式会社内
最終頁に続く

(54)【発明の名称】炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患の治療剤

(57)【特許請求の範囲】
【請求項１】
炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患からなる群から選択される少なくとも１種の疾患の治療のための治療剤であり、下記一般式（１）で表される化合物及びその薬理的に許容される塩からなる群から選択される少なくとも１種を有効成分として含有する、治療剤。
【化１】



(1)

［式（１）中、
R^1及びR^2は、同一でも異なっていてもよく、それぞれ、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキル基、置換されていてもよいC_{6-10}単環若しくは多環式アリール基、置換されていてもよいC_{7-11}単環若しくは多環式アラルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ

原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式芳香族性複素環基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式非芳香族性複素環基、置換されていてもよいジC_{1-6}アルキルアミノ基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキルアミノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アシルアミノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシ基、置換されていてもよいC_{2-6}アルケニルオキシ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよいC_{6-10}単環若しくは多環式アリールオキシ基、置換されていてもよいC_{7-11}単環若しくは多環式アラルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルチオ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルスルホニル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノC_{1-6}アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジC_{1-6}アルキルスルファモイル基［ジC_{1-6}アルキルスルファモイル基内の２つのC_{1-6}アルキル基は隣接する窒素原子と一体となってピロリジン－１－イル基又はモルホリノ基を形成してもよい］、スルファモイル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルカルボニル基、置換されていてもよい１－（C_{1-6}アルキルオキシ）イミノC_{1-6}アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノC_{1-6}アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジC_{1-6}アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいC_{7-11}単環若しくは多環式アラルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシカルボニル基、又は置換されていてもよいヒドロキシアミノカルボニル基を示し、

R^3は水素原子を示し、

R^4は、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式複素環基を示し、

Ｘは、次式：－CH_2－、－CH_2－CH_2－、－CH_2－CH_2－CH_2－、又は－CH_2－Ｏ－CH_2－で示される基を示し、

Ｚは、水素原子又は水酸基を示す。］

【請求項２】

前記一般式（１）で表される化合物が、

R^1が、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環基、置換されていてもよいC_{1-6}アシルアミノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルチオ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルスルホニル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノC_{1-6}アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジC_{1-6}アルキルスルファモイル基［ジC_{1-6}アルキルスルファモイル基内の２つのC_{1-6}アルキル基は隣接する窒素原子と一体となってピロリジン－１－イル基又はモルホリノ基を形成してもよい］、スルファモイル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルカルボニル基、置換

されていてもよい１－（Ｃ$_{1-6}$アルキルオキシ）イミノＣ$_{1-6}$アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{7-11}$単環式アラルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシカルボニル基、又は置換されていてもよいヒドロキシアミノカルボニル基を示し、

Ｒ^{2}が、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アシルアミノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{2-6}$アルケニルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルチオ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルホニル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基、スルファモイル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルカルボニル基、置換されていてもよい１－（Ｃ$_{1-6}$アルキルオキシ）イミノＣ$_{1-6}$アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{7-11}$単環若しくは多環式アラルキルアミノカルボニル基、又は置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシカルボニル基を示す、

化合物である、請求項１に記載の治療剤。

【請求項３】

前記一般式（１）で表される化合物が、

Ｒ^{1}が、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アシルアミノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルチオ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルホニル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基［ジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基内の２つのＣ$_{1-6}$アルキル基は隣接する窒素原子と一体となってピロリジン－１－イル基又はモルホリノ基を形成してもよい］、スルファモイル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルカルボニル基、置換されていてもよい１－（Ｃ$_{1-6}$アルキルオキシ）イミノＣ$_{1-6}$アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シ

クロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{7-11}$単環式アラルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシカルボニル基、又は置換されていてもよいヒドロキシアミノカルボニル基を示し、

Ｒ^{2}が水素原子を示す、

化合物である、請求項１に記載の治療剤。

【請求項４】

前記一般式（１）で表される化合物が、

Ｒ^{1}が水素原子を示し、

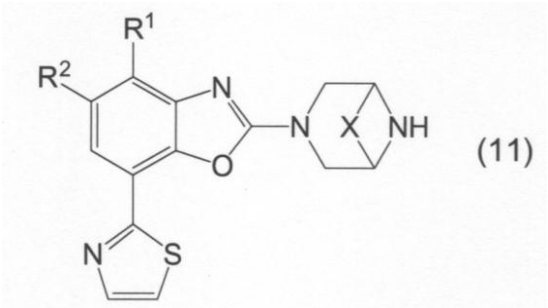
Ｒ^{2}が、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アシルアミノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{2-6}$アルケニルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルチオ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルホニル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基、スルファモイル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルカルボニル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよい１－（Ｃ$_{1-6}$アルキルオキシ）イミノＣ$_{1-6}$アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{7-11}$単環若しくは多環式アラルキルアミノカルボニル基、又は置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシカルボニル基を示す、

化合物である、請求項１に記載の治療剤。

【請求項５】

前記一般式（１）で表される化合物が、下記一般式（１１）で表される化合物である、請求項１に記載の治療剤。

【化２】



(11)

［式（１１）中、

Ｒ^{1}は、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキル基、又は置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシ基を示し、

Ｒ^{2}は、水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキル基、又は置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルカルボニル基を示し、

Ｘは、次式：－ＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$－ＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$－ＣＨ$_{2}$－ＣＨ$_{2}$－、又は－ＣＨ$_{2}$－Ｏ－ＣＨ$_{2}$－で示される基を示す。］

【請求項６】

前記一般式（１）で表される化合物及びその薬理的に許容される塩からなる群から選択される少なくとも１種のＰＤＥ４阻害活性が、ＰＤＥ４活性を５０％阻害する濃度（ＩＣ

５０）で、１１ｎＭ以下である、請求項１～５のうちのいずれか一項に記載の治療剤。
【請求項７】
前記一般式（１）で表される化合物が、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
７－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（フラン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（オキサゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
７－（５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
７－（５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン、
７－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］

ノナン、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
７－（５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
Ｎ－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）アセトアミド、
Ｎ－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）アセトアミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（メチルスルホ

ニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
Ｎ－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド、
Ｎ－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド、
Ｎ－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－オール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－イソプロポキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキ

シエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（オキセタン－３－イルメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）メチル）プロパン－１，３－ジオール、
５－（アリルオキシ）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）アセトニトリル、
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）酢酸、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－オール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－シクロブトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）アセトニトリル、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３－メトキシプロパン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４，７－ジ（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－７－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－７－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレー

ト、
エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（モルホリノ）メタノン、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（ピペリジン－１－イル）メタノン、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（アゼチジン－１－イル）メタノン、
Ｎ－ベンジル－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド、
Ｎ－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－Ｎ－メチルアセトアミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（モルホリノメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルメタンアミン、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール、
（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール、
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート、
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート、
エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（モルホリノ）メタノン、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（ピペリジン－１－イル）メタノン、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（Ｒ）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ

［ｄ］オキサゾール、
（Ｓ）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
（Ｒ）－２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
（Ｓ）－２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフ

ルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエチルアセテート、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（Ｒ）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（Ｓ）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）エタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル、
２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）プロパン－２－オール、
１－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾ

ール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メトキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）メタノール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ

）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（アゼチジン－１－イル）メタノン、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（３－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）アゼチジン－１－イル）メタノン、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）メタノール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２－メチルプロパン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７

－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
（Ｅ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム、
（Ｚ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム、
（Ｅ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム、
（Ｚ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）エタン－１－オール、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）エタン－１－オール、
２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
４－（１－（（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
４－（１－（（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）メチル）シクロプロパン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
（Ｒ）－２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
（Ｓ）－２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベ

ンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
メチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボン酸、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）プロパン－２－オール、
１－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オン、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
（Ｒ）－１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
（Ｓ）－１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）酢酸、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２－メチルプロパン－２－オール、

２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトアミド、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）プロパン－２－オール、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）プロパン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（ジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロブタン－１－カルボニトリル、
２－（３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロブチル）プロパン－２－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２－メチルプロパン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）シクロプロパン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）シクロプロパン－１－オール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２－メチルプロパン－２－オール、
３－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－

（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２，３－ジメチルブタン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－メトキシシクロプロピル）メトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシシクロプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２－メチルプロパン－２－オール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロブタン－１－オール、
１－（（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）メチル）シクロプロパン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
４－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－４，４－ジフルオロ－２－メチルブタン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）シクロプロパン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、

（Ｒ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
４－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロヘキサン－１－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－４，４，４－トリフルオロ－２－メチルブタン－２－オール、
４－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）テトラヒドロ－２Ｈ－チオピラン　１，１－ジオキシド、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオ

ロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（（Ｓ）－テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（（Ｒ）－テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（オキセタン－３－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロ－２－メチルプロパン－１，２－ジオール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（ピリミジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（イソチアゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，

１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（３－メチル－１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（（トリフルオロメチル）スルホニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボニトリル、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピリジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピリミジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピラジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（６－メチル－４－（トリフルオロメチル）ピリダジン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（６－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）メタノール、
（６－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－５－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル）メタノール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（（５－（トリフルオロメトキシ）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－シクロプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）チオ）エタン－１－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）スルフィニル）エタン－１－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）スルホニル）エタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（１，１－ジフルオロアリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（５－（メ

チルスルホニル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－シクロプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－エチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（モルホリノ）メタノン、
（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（ピロリジン－１－イル）メタノン、
Ｎ－ベンジル－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－３－メチルブタン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（５－クロロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
（Ｒ）－３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロ－２－メチルプロパン－１，２－ジオール、
（Ｓ）－３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロ－２－メチルプロパン－１，２－ジオール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボン酸、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－モルホリノ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロプロパン－１，２－ジオール、
３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ

［３．１．１］ヘプタン－６－オール、
（Ｒ）－３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール、
（Ｓ）－３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール、
３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール、
３－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
（２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）メタノール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２，２－ジオール、
（Ｒ）－３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
（Ｓ）－３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール、
３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－

４－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピロリジン－１－イルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（モルホリノスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１，１－ジフルオロ－２－メトキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１，１－ジフルオロ－２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロブタン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）ピペリジン－４－オール、
４－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）チオモルホリン　１，１－ジオキシド、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－ブロモ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１，１－ジフルオロプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
４－（ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イルジフルオロメトキシ）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（１，１－ジフルオロ－３－（ピリジン－３－イル）アリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルアセトアミド、

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－１－モルホリノエタン－１－オン、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロアセトアミド、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アセトアミド、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－１－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）エタン－１－オン、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－シクロブチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピロリジン－１－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（６－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）メタノール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボニトリル、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（ピリジン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、又は
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－シクロブトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
である、請求項１に記載の治療剤。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【０００１】

本発明は、炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患の治療剤に関し、より詳しくは、ＰＤＥ４阻害活性を有する化合物を含有する炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患の治療剤に関する。

【背景技術】

【０００２】

ホスホジエステラーゼ（ＰＤＥ）は、セカンドメッセンジャーであるサイクリックヌクレオチド（ｃＡＭＰやｃＧＭＰ）に存在するリン酸ジエステル結合の片側を加水分解することで、これらを不活性化する重要な生体酵素として知られている。ｃＡＭＰを分解するＰＤＥはいくつかのアイソフォームに分類され、その中でも４型のＰＤＥ（ＰＤＥ４）は、多くの炎症性細胞、免疫細胞、血液、脳や肺などの臓器に存在する主要なｃＡＭＰ分解酵素の１つである（非特許文献１：Ｉｎｔｅｒｎａｔｉｏｎａｌ Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｃｈｒｏｎｉｃ Ｏｂｓｔｒｕｃｔｉｖｅ Ｐｕｌｍｏｎａｒｙ Ｄｉｓｅａｓｅ，２００８，３（４），ｐ．５４３－５６１参照）。

【０００３】

ＰＤＥ４阻害活性を有する化合物（ＰＤＥ４阻害薬）を含有するＰＤＥ４阻害剤は、Ｔ

ＮＦ－αやＩＬ－２３など各種炎症性サイトカインの産生、放出を抑制することから、ＴＮＦ－αなどが関与する各種炎症性疾患の治療に有用であることが知られている（非特許文献２：Ｅｘｐｅｒｔ Ｏｐｉｎｉｏｎ ｏｎ Ｉｎｖｅｓｔｉｇａｔｉｏｎａｌ Ｄｒｕｇｓ，２００２，１１（１），ｐ．１－１３参照）。また、ＰＤＥ４阻害剤は、呼吸器系の炎症疾患（喘息や慢性閉塞性肺疾患（ＣＯＰＤ））に加えて皮膚の炎症性疾患（乾癬、アトピー性皮膚炎）に対しても効果を示すことが報告されているほか、アレルギー性結膜炎、ドライアイなどの目の炎症性疾患（非特許文献３：Ｌｉｆｅ Ｓｃｉｅｎｃｅｓ，２００６，７８，ｐ．２６６３－２６６８参照；非特許文献４：Ｉｎｖｅｓｔｉｇａｔｉｖｅ Ｏｐｈｔｈａｌｍｏｌｏｇｙ ＆ Ｖｉｓｕａｌ Ｓｃｉｅｎｃｅ，２０１２，５３，ｐ．３５８４－３５９１参照）、うつ病、記憶障害などの精神疾患に対しても効果を示す可能性が報告されている（非特許文献２参照）。さらに、ＰＤＥ４阻害剤は動物モデルでは特発性肺線維症などの間質性肺炎に対する有効性も示唆されている（非特許文献５：Ｂｒｉｔｉｓｈ Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｏｌｏｇｙ，２００９，１５６，ｐ．５３４－５４４参照）。また、線維芽細胞の機能にＰＤＥ４が関与していることから多様な線維化疾患（非特許文献６：Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｃｅｌｌｕｌａｒ Ｐｈｙｓｉｏｌｏｇｙ，２０１１，２２６，ｐ．１９７０－１９８０参照）やその一種である全身性強皮症（非特許文献７：Ａｎｎａｌｓ ｏｆ ｔｈｅ Ｒｈｅｕｍａｔｉｃ Ｄｉｓｅａｓｅｓ ２０１７，７６，ｐ.１１３３－１１４１参照）、非アルコール性脂肪性肝炎（非特許文献８：Ｄｉａｂｅｔｅｓ Ｏｂｅｓ Ｍｅｔａｂ.，２０１７，１９，ｐ．４９６－５０８参照）、筋ジストロフィー（非特許文献９：Ｔｈｅ ＦＡＳＥＢ Ｊｏｕｒｎａｌ， ２０１７，３１，ｐ．５３０７－５３２０参照）に対する有効性も示唆されている。

【０００４】

近年では、大腸がん患者由来細胞においてＰＤＥ４が過剰発現しており、その阻害剤は抗腫瘍活性を有することが知られている（非特許文献１０：Ｍｏｌｅｃｕｌａｒ Ｃａｎｃｅｒ，２０１２，１１：４６参照）。また、肺がんの増殖や血管新生にＰＤＥ４が関与しているとの報告もあり、その阻害剤は肺がんに対しても効果を示す可能性がある（非特許文献１１：Ｏｎｃｏｇｅｎｅ，２０１３，３２，ｐ．１１２１－１１３４参照）ほか、脳腫瘍（非特許文献１２：Ｔｒｅｎｄｓ ｉｎ Ｐｈａｒｍａｃｏｌｏｇｉｃａｌ Ｓｃｉｅｎｃｅｓ，Ｊｕｎｅ ２０１１，Ｖｏｌ．３２，Ｎｏ．６，ｐ．３３７－３４４参照）や急性リンパ性白血病（非特許文献１３：Ｂｌｏｏｄ，Ｍａｙ ２００２，Ｖｏｌ．９９，Ｎｏ．９，ｐ．３３９０－３３９７参照）に対する有望な治療法となり得る可能性などが指摘されており、各種のがんに対してＰＤＥ４阻害剤は有効である可能性がある。

【０００５】

また、肥満や糖尿病などの代謝性疾患（非特許文献１４：Ｃｅｌｌ １４８，Ｆｅｂｒｕａｒｙ ２０１２，ｐ．４２１－４３３参照）や加齢、アルツハイマー病、パーキンソン病、統合失調症、ハンチントン病に伴う認知障害に対してもＰＤＥ４阻害剤が有効である可能性が報告されている（非特許文献１５：Ｅｘｐｅｒｔ Ｏｐｉｎｉｏｎ ｏｎ Ｔｈｅｒａｐｅｕｔｉｃ Ｔａｒｇｅｔｓ，Ｓｅｐｔｅｍｂｅｒ ２０１３，１７（９），ｐ．１０１１－１０２７参照）。

【０００６】

非選択的ＰＤＥ阻害薬として知られているテオフィリンは、従来から喘息の治療に用いられている（非特許文献１６：Ｂｒｉｔｉｓｈ Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｏｌｏｇｙ，２００８，１５５，ｐ．３０８－３１５参照）。また、非選択的ＰＤＥ阻害薬のイブジラストはその抗炎症作用、血管拡張作用により、気管支喘息、脳血管障害に対して治療効果を示している（非特許文献１７：Ｅｘｐｅｒｔ Ｏｐｉｎｉｏｎ ｏｎ Ｐｈａｒｍａｃｏｔｈｅｒａｐｙ，２００９，１０，ｐ．２８９７－２９０４参照）ほか、アレルギー性結膜炎（目薬）でも使用されており（非特許文献１８：Ｅｙｅ Ｃｏｎｔａｃｔ Ｌｅｎｓ，Ｓｅｐｔｅｍｂｅｒ ２００９，Ｖｏｌ．３５，Ｎｏ．５，ｐ．２５１－２５４参照）、また多発性硬化症や神経因性疼痛に対しても効果が期待されている（非

特許文献１９：Ｅｘｐｅｒｔ Ｏｐｉｎｉｏｎ ｏｎ Ｉｎｖｅｓｔｉｇａｔｉｏｎａｌ Ｄｒｕｇｓ，２０１６，Ｖｏｌ．２５，Ｎｏ．１０，ｐ．１２３１－１２３７参照）。強力な経口ＰＤＥ４阻害薬であるロフルミラストは欧米で慢性閉塞性肺疾患（ＣＯＰＤ）を適用疾患として認可、使用されている（非特許文献２０：Ｂｒｉｔｉｓｈ Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｏｌｏｇｙ，２０１１，１６３，ｐ．５３－６７参照）ほか、動物モデルでは特発性肺線維症などの間質性肺炎（非特許文献５参照）、非アルコール性脂肪性肝炎（非特許文献８参照）に対する有効性も示唆されている。また、肥満や認知症、アトピー性皮膚炎（非特許文献２１：Ｎａｔｕｒｅ Ｒｅｖｉｅｗｓ Ｄｒｕｇ Ｄｉｓｃｏｖｅｒｙ，Ａｐｒｉｌ ２０１４，Ｖｏｌ．１３，ｐ．２９０－３１４参照）に対しても臨床試験が行われている。また、糖尿病患者に対して血糖値を下げる効果も報告されている（非特許文献２２：Ｔｈｅ Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｃｌｉｎｉｃａｌ Ｅｎｄｏｃｒｉｎｏｌｏｇｙ ＆ Ｍｅｔａｂｏｌｉｓｍ，Ｓｅｐｔｅｍｂｅｒ ２０１２，９７（９），ｐ．１７２０－１７２５参照）。また近年、同じく経口ＰＤＥ４阻害薬であるアプレミラストが欧米で関節症性乾癬及び尋常性乾癬に対する治療薬として認可され、広く使用されているほか、ニキビ、強直性脊椎炎、リウマチ、ベーチェット病、潰瘍性大腸炎、アトピー性皮膚炎、円形脱毛症、白斑、化膿性汗腺炎、扁平苔癬に対しても臨床試験が行われている（非特許文献２０及び非特許文献２３：Ｄｒｕｇｓ，２０１４，７４，ｐ．８２５－８３７、非特許文献２４：Ｓｕｍｍｅｒ Ｍｅｅｔｉｎｇ ｏｆ ｔｈｅ Ａｍｅｒｉｃａｎ Ａｃａｄｅｍｙ ｏｆ Ｄｅｒｍａｔｏｌｏｇｙ（ＡＡＤ） ２０１６，Ａｂｓｔｒａｃｔ ４０７０、非特許文献２５：Ｃａｓｅ Ｒｅｐｏｒｔｓ ｉｎ Ｄｅｒｍａｔｏｌｏｇｉｃａｌ Ｍｅｄｉｃｉｎｅ ２０１７，Ａｒｔｉｃｌｅ ＩＤ ２３８６２３４、非特許文献２６：Ｊ Ａｍ Ａｃａｄ Ｄｅｒｍａｔｏｌ ２０１７，７６，６，ｐ．１１８９－１１９１、非特許文献２７：Ｃａｓｅ Ｒｅｐ Ｄｅｒｍａｔｏｌ ２０１６，８，ｐ．２２４－２２６参照）。外用ＰＤＥ４阻害薬であるクリサボロールは臨床試験において小児及び成人のアトピー性皮膚炎に対して効果があると報告されている（非特許文献２８：Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ ｔｈｅ Ａｍｅｒｉｃａｎ Ａｃａｄｅｍｙ ｏｆ Ｄｅｒｍａｔｏｌｏｇｙ，Ｓｅｐｔｅｍｂｅｒ ２０１６，Ｖｏｌ．７５，Ｎｏ．３，ｐ．４９４－５０３参照）。その他にも種々の炎症性疾患（クローン病や潰瘍性大腸炎等の炎症性腸疾患、多発性硬化症、リウマチ、サルコイドーシス、ベーチェット病、鼻炎）に対してＰＤＥ４阻害剤の臨床試験が実施されているほか、非臨床試験において全身性エリテマトーデスに対する可能性も指摘されている。さらにＰＤＥ４阻害活性を有する化合物には中枢作用を有する化合物も多く、うつ病、パーキンソン病、学習及び記憶障害、アルツハイマー病に対する効果の報告もある（非特許文献２及び非特許文献２９：ＢＭＣ Ｍｅｄｉｃｉｎｅ，２０１３，１１：９６参照）。

【０００７】

このように、ＰＤＥ４阻害活性を有する化合物は、喘息、ＣＯＰＤ、間質性肺炎、特発性肺線維症、全身性強皮症、非アルコール性脂肪性肝炎、筋ジストロフィーなどの各種線維化疾患、クローン病や潰瘍性大腸炎などの炎症性腸疾患、多発性硬化症、リウマチ、強直性脊椎炎、ニキビ、アトピー性皮膚炎、円形脱毛症、白斑、化膿性汗腺炎、扁平苔癬、アレルギー性結膜炎、ドライアイ、鼻炎、関節症性乾癬、尋常性乾癬、サルコイドーシス、ベーチェット病、全身性エリテマトーデス、脳血管障害、神経因性疼痛、うつ病、認知障害、学習障害、パーキンソン病、アルツハイマー病、ハンチントン病、統合失調症、各種がん（大腸がん、肺がん、血液がん、脳腫瘍など）、代謝性疾患（糖尿病、肥満など）といった種々の疾患に効果を示す可能性があると考えられている。

【０００８】

また、特許文献１（特開平６－３４５７４４号公報）及び特許文献２（特開平１０－２９９８７号公報）には、ベンゾオキサゾール誘導体のセロトニン５－ＨＴ$_3$に対する活性が報告されている。加えて、特許文献３（国際公開第２０１５／００５４２９号）には、ＰＤＥ４阻害活性を有するベンゾオキサゾール誘導体の報告がある。しかしながら、これらのベンゾオキサゾール２位置換基はいずれも単環性の複素環である。

【先行技術文献】
【特許文献】
【０００９】
【特許文献１】特開平６－３４５７４４号公報
【特許文献２】特開平１０－２９９８７号公報
【特許文献３】国際公開第２０１５／００５４２９号
【非特許文献】
【００１０】
【非特許文献１】Ｈａｌｐｉｎ Ｄ．ＭＧ．，Ｉｎｔｅｒｎａｔｉｏｎａｌ Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｃｈｒｏｎｉｃ Ｏｂｓｔｒｕｃｔｉｖｅ Ｐｕｌｍｏｎａｒｙ Ｄｉｓｅａｓｅ，２００８，３（４），ｐ．５４３－５６１
【非特許文献２】Ｄｙｋｅ Ｈ．Ｊ．ａｎｄ Ｍｏｎｔａｎａ Ｊ．Ｇ．，Ｅｘｐｅｒｔ Ｏｐｉｎｉｏｎ ｏｎ Ｉｎｖｅｓｔｉｇａｔｉｏｎａｌ Ｄｒｕｇｓ，２００２，１１（１），ｐ．１－１３
【非特許文献３】Ｈｕａｎｇ Ｚ ｅｔ ａｌ．Ｌｉｆｅ Ｓｃｉｅｎｃｅｓ，２００６，７８，ｐ．２６６３－２
【非特許文献４】Ｓａｄｒａｉ ｅｔ ａｌ．，Ｉｎｖｅｓｔｉｇａｔｉｖｅ Ｏｐｈｔｈａｌｍｏｌｏｇｙ ＆ Ｖｉｓｕａｌ Ｓｃｉｅｎｃｅ，２０１２，５３，ｐ．３５８４－３５９１
【非特許文献５】Ｃｏｒｔｉｊｏ Ｊ．ｅｔ ａｌ．，Ｂｒｉｔｉｓｈ Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｏｌｏｇｙ，２００９，１５６，ｐ．５３４－５４４
【非特許文献６】Ｓｅｌｉｇｅ Ｊ．ｅｔ ａｌ．，Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｃｅｌｌｕｌａｒ Ｐｈｙｓｉｏｌｏｇｙ，２０１１，２２６，ｐ．１９７０－１９８０
【非特許文献７】Ｍａｉｅｒ Ｃ．ｅｔ ａｌ．，Ａｎｎａｌｓ ｏｆ ｔｈｅ Ｒｈｅｕｍａｔｉｃ Ｄｉｓｅａｓｅｓ ２０１７，７６，ｐ．１１３３－１１４１
【非特許文献８】Ｍｏｅｌｌｍａｎｎ Ｊ ｅｔ ａｌ．，Ｄｉａｂｅｔｅｓ Ｏｂｅｓ Ｍｅｔａｂ．，２０１７，１９，ｐ．４９６－５０８
【非特許文献９】Ｎｉｏ Ｙ．ｅｔ ａｌ．，Ｔｈｅ ＦＡＳＥＢ Ｊｏｕｒｎａｌ，２０１７，３１，ｐ．５３０７－５３２０
【非特許文献１０】Ｔｓｕｎｏｄａ Ｔ．ｅｔ ａｌ．，Ｍｏｌｅｃｕｌａｒ Ｃａｎｃｅｒ，２０１２，１１：４６
【非特許文献１１】Ｐｕｌｌａｍｓｅｔｔｉ Ｓ．Ｓ．ｅｔ ａｌ．，Ｏｎｃｏｇｅｎｅ，２０１３，３２，ｐ．１１２１－１１３４
【非特許文献１２】Ｓｅｎｇｕｐｔａ Ｒ．ｅｔ ａｌ．，Ｔｒｅｎｄｓ ｉｎ Ｐｈａｒｍａｃｏｌｏｇｉｃａｌ Ｓｃｉｅｎｃｅｓ，Ｊｕｎｅ ２０１１，Ｖｏｌ．３２，Ｎｏ．６，ｐ．３３７－３４４
【非特許文献１３】Ｏｇａｗａ Ｒ．ｅｔ ａｌ．，Ｂｌｏｏｄ，Ｍａｙ ２００２，Ｖｏｌ．９９，Ｎｏ．９，ｐ．３３９０－３３９７
【非特許文献１４】Ｐａｒｋ Ｓ．－Ｊ．ｅｔ ａｌ．，Ｃｅｌｌ １４８，Ｆｅｂｒｕａｒｙ ２０１２，ｐ．４２１－４３３，２０１２
【非特許文献１５】Ｒｉｃｈｔｅｒ Ｗ．ｅｔ ａｌ．，Ｅｘｐｅｒｔ Ｏｐｉｎｉｏｎ ｏｎ Ｔｈｅｒａｐｅｕｔｉｃ Ｔａｒｇｅｔｓ，Ｓｅｐｔｅｍｂｅｒ ２０１３，１７（９），ｐ．１０１１－１０２７
【非特許文献１６】Ｓｐｉｎａ Ｄ．，Ｂｒｉｔｉｓｈ Ｊｏｕｒｎａｌ ｏｆ Ｐｈａｒｍａｃｏｌｏｇｙ，２００８，１５５，ｐ．３０８－３１５
【非特許文献１７】Ｒｏｌａｎ Ｐ．ｅｔ ａｌ．，Ｅｘｐｅｒｔ Ｏｐｉｎｉｏｎ ｏｎ Ｐｈａｒｍａｃｏｔｈｅｒａｐｙ，２００９，１０，ｐ．２８９７－２９０４
【非特許文献１８】Ｓａｋｕｍａ Ｋ．ｅｔ ａｌ．，Ｅｙｅ Ｃｏｎｔａｃｔ Ｌｅｎｓ，Ｓｅｐｔｅｍｂｅｒ ２００９，Ｖｏｌ．３５，Ｎｏ．５，ｐ．２５１－２５４
【非特許文献１９】Ｇｏｏｄｍａｎ Ａ．Ｄ．ｅｔ ａｌ．，Ｅｘｐｅｒｔ Ｏｐｉｎ

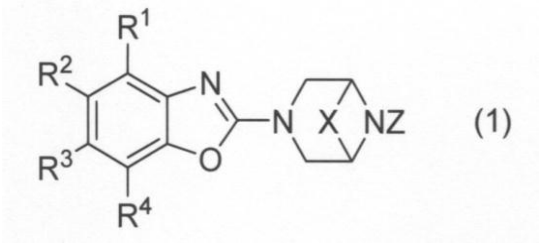
ion on Investigational Drugs, 2016, Vol. 25, No. 10, p. 1231－1237
【非特許文献２０】Rabe K. F., British Journal of Pharmacology, 2011, 163, p. 53－67
【非特許文献２１】Maurice D. H. et al., Nature Reviews Drug Discovery, April 2014, Vol. 13, p. 290－314
【非特許文献２２】Wouters E. F. W. et al., The Journal of Clinical Endocrinology & Metabolism, September 2012, 97（9）, p. 1720－1725
【非特許文献２３】Poole R. M. et al., Drugs, 2014, 74, p. 825－837
【非特許文献２４】Shrager D., Summer Meeting of the American Academy of Dermatology（AAD） 2016, Abstract 4070
【非特許文献２５】Huff S. B and Gottwald L. D., Case Reports in Dermatological Medicine 2017, Article ID 2386234
【非特許文献２６】Weber P. et al., J Am Acad Dermatol 2017, 76, 6, p. 1189－1191
【非特許文献２７】Hafner J. et al., Case Rep Dermatol 2016, 8, p. 224－226
【非特許文献２８】Paller A. S. et al., Journal of the American Academy of Dermatology, September 2016, Vol. 75, No. 3, p. 494－503
【非特許文献２９】Kumar N. et al., BMC Medicine, 2013, 11：96

【発明の概要】
【発明が解決しようとする課題】
【００１１】
従来のＰＤＥ４阻害剤においては、経口投与時及び外用投与時のＰＤＥ４阻害活性による薬効が十分とはいえず、また、ＰＤＥ４阻害剤が効果を示す可能性があると考えられている上記の種々の疾患に効果を示すとは限らなかった。さらに、種々のＰＤＥ４阻害活性を有する化合物がいずれの疾患に有効であるかは十分に明らかではなかった。
【００１２】
本発明は上記従来技術の有する課題に鑑みてなされたものであり、優れたＰＤＥ４阻害活性を有する化合物を含有し、炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患の治療に有用な治療剤を提供することを目的とする。
【課題を解決するための手段】
【００１３】
本発明者らは、上記課題を解決すべく鋭意研究を行った結果、二環性ピペラジン環を有するベンゾオキサゾール誘導体及びその薬理的に許容される塩が、優れたＰＤＥ４阻害活性を有し、かつ、炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患の治療に有用であることを見出し、本発明を完成した。
【００１４】
すなわち、本発明は、
［１］
炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患からなる群から選択される少なくとも１種の疾患の治療のための治療剤であり、下記一般式（１）で表される化合物及びその薬理的に許容される塩からなる群から選択される少なくとも１種を有効成分として含

有する治療剤。

【００１５】

【化１】



【００１６】

［式（１）中、

Ｒ^{1}及びＲ^{2}は、同一でも異なっていてもよく、それぞれ、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキル基、置換されていてもよいＣ$_{6-10}$単環若しくは多環式アリール基、置換されていてもよいＣ$_{7-11}$単環若しくは多環式アラルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式芳香族性複素環基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式非芳香族性複素環基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルアミノ基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルアミノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アシルアミノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{2-6}$アルケニルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{6-10}$単環若しくは多環式アリールオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{7-11}$単環若しくは多環式アラルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルチオ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルホニル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基［ジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基内の２つのＣ$_{1-6}$アルキル基は隣接する窒素原子と一体となってピロリジン－１－イル基又はモルホリノ基を形成してもよい］、スルファモイル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルカルボニル基、置換されていてもよい１－（Ｃ$_{1-6}$アルキルオキシ）イミノＣ$_{1-6}$アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{7-11}$単環若しくは多環式アラルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシカルボニル基、又は置換されていてもよいヒドロキシアミノカルボニル基を示し、

Ｒ^{3}は水素原子を示し、

Ｒ^{4}は、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式複素環基を示し、

Ｘは、次式：－ＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$－ＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$－ＣＨ$_{2}$－ＣＨ$_{2}$－、又は－ＣＨ$_{2}$－Ｏ－ＣＨ$_{2}$－で示される基を示し、

Ｚは、水素原子又は水酸基を示す。］

［２］

前記一般式（１）で表される化合物が、

R^1が、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環基、置換されていてもよいC_{1-6}アシルアミノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルチオ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルスルホニル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノC_{1-6}アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジC_{1-6}アルキルスルファモイル基［ジC_{1-6}アルキルスルファモイル基内の２つのC_{1-6}アルキル基は隣接する窒素原子と一体となってピロリジン－１－イル基又はモルホリノ基を形成してもよい］、スルファモイル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルカルボニル基、置換されていてもよい１－（C_{1-6}アルキルオキシ）イミノC_{1-6}アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノC_{1-6}アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジC_{1-6}アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいC_{7-11}単環式アラルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシカルボニル基、又は置換されていてもよいヒドロキシアミノカルボニル基を示し、

R^2が、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環基、置換されていてもよいC_{1-6}アシルアミノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシ基、置換されていてもよいC_{2-6}アルケニルオキシ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルチオ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルスルホニル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノC_{1-6}アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジC_{1-6}アルキルスルファモイル基、スルファモイル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルカルボニル基、置換されていてもよい１－（C_{1-6}アルキルオキシ）イミノC_{1-6}アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノC_{1-6}アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジC_{1-6}アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいC_{7-11}単環若しくは多環式アラルキルアミノカルボニル基、又は置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシカルボニル基を示す、

化合物である［１］に記載の治療剤。

［３］

前記一般式（１）で表される化合物が、

R^1が、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含

む４～１０員の単環式芳香族性複素環基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アシルアミノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルチオ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルホニル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基［ジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基内の２つのＣ$_{1-6}$アルキル基は隣接する窒素原子と一体となってピロリジン－１－イル基又はモルホリノ基を形成してもよい］、スルファモイル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルカルボニル基、置換されていてもよい１－（Ｃ$_{1-6}$アルキルオキシ）イミノＣ$_{1-6}$アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{7-11}$単環式アラルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシカルボニル基、又は置換されていてもよいヒドロキシアミノカルボニル基を示し、

Ｒ^{2}が水素原子を示す、

化合物である［１］に記載の治療剤。

［４］

前記一般式（１）で表される化合物が、

Ｒ^{1}が水素原子を示し、

Ｒ^{2}が、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アシルアミノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{2-6}$アルケニルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルチオ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルホニル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基、スルファモイル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルカルボニル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよい１－（Ｃ$_{1-6}$アルキルオキシ）イミノＣ$_{1-6}$アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{7-11}$単環若しくは多環式アラルキルアミノカルボニル基、又は置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシカルボニル基を示す、

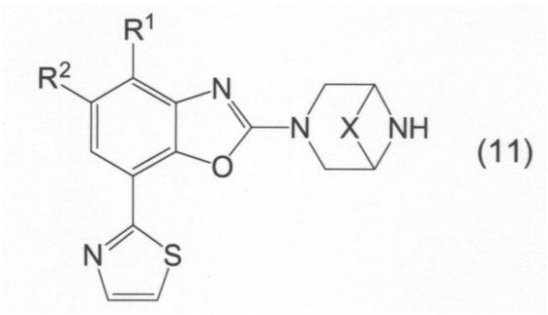
化合物である［１］に記載の治療剤。

［５］

前記一般式（１）で表される化合物が、下記一般式（１１）で表される化合物である、［１］に記載の治療剤。

【００１７】

【化２】



【００１８】

［式（１１）中、

Ｒ^{1}は、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキル基、又は置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシ基を示し、

Ｒ^{2}は、水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキル基、又は置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルカルボニル基を示し、

Ｘは、次式：－ＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$－ＣＨ$_{2}$－、－ＣＨ$_{2}$－ＣＨ$_{2}$－ＣＨ$_{2}$－、又は－ＣＨ$_{2}$－Ｏ－ＣＨ$_{2}$－で示される基を示す。］

［６］

前記一般式（１）で表される化合物及びその薬理的に許容される塩からなる群から選択される少なくとも１種のＰＤＥ４阻害活性が、ＰＤＥ４活性を５０％阻害する濃度（ＩＣ５０）で、１１ｎＭ以下である、［１］～［５］のうちのいずれか一項に記載の治療剤。

［７］

前記一般式（１）で表される化合物が、

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、

７－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン、

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（フラン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（オキサゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－クロロ－７－（

ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
７－（５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
７－（５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン、
７－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
７－（５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
Ｎ－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾ

ール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）アセトアミド、
Ｎ－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）アセトアミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
Ｎ－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド、
Ｎ－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド、
Ｎ－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－

２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－オール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－イソプロポキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（オキセタン－３－イルメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）メチル）プロパン－１，３－ジオール、
５－（アリルオキシ）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）アセトニトリル、
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）酢酸、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－オール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－シクロブトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）アセトニトリル、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３－メトキシプ

ロパン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４，７－ジ（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－７－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－７－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（モルホリノ）メタノン、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（ピペリジン－１－イル）メタノン、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（アゼチジン－１－イル）メタノン、
Ｎ－ベンジル－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド、
Ｎ－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－Ｎ－メチルアセトアミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（モルホリノ

メチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルメタンアミン、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール、
（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール、
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート、
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート、
エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（モルホリノ）メタノン、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（ピペリジン－１－イル）メタノン、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、

（Ｒ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（Ｒ）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（Ｓ）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
（Ｒ）－２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
（Ｓ）－２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾ

ール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエチルアセテート、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（Ｒ）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（Ｓ）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフ

ルオロエトキシ）エタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル、
２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）プロパン－２－オール、
１－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾ

ール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メトキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）メタノール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（アゼチジン－１－イル）メタノン、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（３－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）アゼチジン－１－イル）メタノン、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）メタノール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

－５－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２－メチルプロパン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チア

ゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
（Ｅ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム、
（Ｚ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム、
（Ｅ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム、
（Ｚ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）エタン－１－オール、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）エタン－１－オール、
２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
４－（１－（（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、

４－（１－（（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）メチル）シクロプロパン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
（Ｒ）－２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
（Ｓ）－２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
メチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボン酸、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）プロパン－２－オール、
１－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オン、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チ

アゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
（Ｒ）－１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
（Ｓ）－１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）酢酸、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトアミド、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）プロパン－２－オール、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）プロパン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（ジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロブタン－１－カルボニトリル、
２－（３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７

－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロブチル）プロパン－２－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２－メチルプロパン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）シクロプロパン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）シクロプロパン－１－オール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２－メチルプロパン－２－オール、
３－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２，３－ジメチルブタン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－メトキシシクロプロピル）メトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシシクロプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２－メチルプロパン－２－オール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロブタン－１－オール、
１－（（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）メチル）シクロプロパン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（オ

キサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
４－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－４，４－ジフルオロ－２－メチルブタン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）シクロプロパン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
４－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロヘキサン－１－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－４，４，４－トリフルオロ－２－メチルブタン－２－オール、
４－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）テトラヒドロ－２Ｈ－チオピラン　１，１－ジオキシド、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（（Ｓ）－テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（（Ｒ）－テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（オキセタン－３－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、

３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロ－２－メチルプロパン－１，２－ジオール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（ピリミジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（イソチアゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（３－メチル－１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（（トリフルオロメチル）スルホニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボニトリル、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピリジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピリミジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピラジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（６－メチル－４－（トリフルオロメチル）ピリダジン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（６－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）メタノール、
（６－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－５－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル）メタノール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（（５－（トリフルオロメトキシ）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－シクロプロピ

ル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）チオ）エタン－１－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）スルフィニル）エタン－１－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）スルホニル）エタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（１，１－ジフルオロアリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（５－（メチルスルホニル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－シクロプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－エチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（モルホリノ）メタノン、
（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（ピロリジン－１－イル）メタノン、
Ｎ－ベンジル－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－３－メチルブタン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（５－クロロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、

（Ｒ）－３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロ－２－メチルプロパン－１，２－ジオール、
（Ｓ）－３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロ－２－メチルプロパン－１，２－ジオール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボン酸、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－モルホリノ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロプロパン－１，２－ジオール、
３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール、
（Ｒ）－３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール、
（Ｓ）－３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール、
３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール、
３－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
（２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）メタノール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２，２－ジオール、
（Ｒ）－３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
（Ｓ）－３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール、
３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、

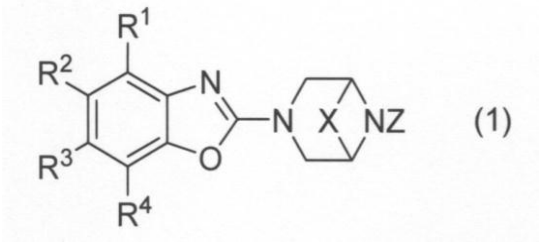
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピロリジン－１－イルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（モルホリノスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１，１－ジフルオロ－２－メトキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１，１－ジフルオロ－２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロブタン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）ピペリジン－４－オール、
４－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）チオモルホリン　１，１－ジオキシド、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－ブロモ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１，１－ジフルオロプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
４－（ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イルジフルオロメトキシ）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（１，１－ジフルオロ－３－（ピリジン－３－イル）アリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルアセトアミド、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－１－モルホリノエタン－１－オン、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロアセトアミド、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アセトアミド、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－１－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）エタン－１－オン、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－シクロブチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピロリジン－１－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（６－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）メタノール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボニトリル、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（ピリジン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、又は
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－シクロブトキ

シ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
である、［１］に記載の治療剤。
［８］
［１］～［７］のうちのいずれか一項に記載の治療剤を患者に投与する、炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患からなる群から選択される少なくとも１種の疾患の治療方法。
［９］
炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患からなる群から選択される少なくとも１種の疾患の治療に使用される、［１］～［７］のうちのいずれか一項に記載の治療剤。

【発明の効果】
【００１９】
本発明によれば、優れたＰＤＥ４阻害活性を有する化合物を含有し、炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患の治療に有用な治療剤を提供することが可能となる。

【発明を実施するための形態】
【００２０】
以下、本発明をその好適な実施形態に即して詳細に説明する。なお、以下の説明中、同一又は相当する要素には同一の記号を付し、重複する説明は省略する。
【００２１】
本発明の治療剤は、炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患からなる群から選択される少なくとも１種の疾患の治療のための治療剤であり、下記一般式（１）で表される化合物及び／又はその薬理的に許容される塩を有効成分として含有する。
【００２２】
【化３】



【００２３】
一般式（１）中、ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を意味し、好ましくは、フッ素原子又は塩素原子である。
【００２４】
一般式（１）中、C_{1-6}アルキル基とは、炭素数１～６の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基を意味する。C_{1-6}アルキル基としては、例えば、メチル基、エチル基、ｎ－プロピル基、イソプロピル基、ｎ－ブチル基、イソブチル基、ｔｅｒｔ－ブチル基、ｎ－ペンチル基、イソアミル基、ｎ－ヘキシル基が挙げられ、好ましくは炭素数１～４の直鎖状又は分枝鎖状のC_{1-4}アルキル基であり、より好ましくはメチル基、エチル基、ｎ－プロピル基、イソプロピル基、ｎ－ブチル基である。
【００２５】
一般式（１）中、C_{3-7}シクロアルキル基とは、炭素数３～７の環状のアルキル基を意味する。C_{3-7}シクロアルキル基としては、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基が挙げられ、好ましくは炭素数３～６のC_{3-6}シクロアルキル基であり、より好ましくはシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基である。
【００２６】
一般式（１）中、C_{6-10}単環若しくは多環式アリール基とは、炭素数６～１０の単

環式芳香族炭化水素基又は多環式芳香族炭化水素基を意味する。C_{6-10}単環若しくは多環式アリール基としては、例えば、フェニル基、ナフチル基が挙げられ、好ましくは単環であり、より好ましくはフェニル基である。

【００２７】

一般式（１）中、C_{7-11}単環若しくは多環式アラルキル基とは、上記C_{1-6}アルキル基の１つの水素原子が炭素数６～１０の単環式芳香族炭化水素基又は多環式芳香族炭化水素基（上記C_{6-10}単環若しくは多環式アリール基）で置換されてなる炭素数７～１１の基を意味する。C_{7-11}単環若しくは多環式アラルキル基としては、例えば、ベンジル基、ナフチルメチル基が挙げられ、好ましくは単環であり、より好ましくはベンジル基である。

【００２８】

一般式（１）中、４～１０員の単環若しくは二環式芳香族性複素環基とは、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環又は二環式芳香族性複素環を意味する。４～１０員の単環若しくは二環式芳香族性複素環基としては、例えば、ピロリル基、フラニル基、チエニル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラジニル基、テトラゾリル基、キノリル基、イソキノリル基が挙げられ、好ましくは単環であり、より好ましくはフラニル基、チエニル基、ピラゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピリミジニル基である。

【００２９】

一般式（１）中、４～１０員の単環若しくは二環式非芳香族性複素環基とは、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環又は二環式非芳香族性複素環を意味する。４～１０員の単環若しくは二環式非芳香族性複素環基としては、例えば、テトラヒドロフラニル基、テトラヒドロピラニル基、テトラヒドロ－２Ｈ－チオピラニル基、オキセタニル基、ピロリジニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、オキサゾリジニル基、モルホリニル基、アジリジニル基、アゼチジニル基、チオモルホリニル基、テトラヒドロキノリル基が挙げられ、好ましくは単環であり、より好ましくはテトラヒドロフラニル基、テトラヒドロピラニル基、テトラヒドロ－２Ｈ－チオピラニル基、オキセタニル基、ピロリジニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、モルホリニル基、アゼチジニル基である。

【００３０】

一般式（１）中、ジC_{1-6}アルキルアミノ基とは、アミノ基の２つの水素原子が上記C_{1-6}アルキル基で置換されてなる基を意味する。ジC_{1-6}アルキルアミノ基としては、例えば、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、メチルエチルアミノ基が挙げられ、好ましくは前記アルキル基の炭素数が１～３であるジC_{1-3}アルキルアミノ基であり、より好ましくはジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基である。

【００３１】

一般式（１）中、C_{3-7}シクロアルキルアミノ基とは、アミノ基の１つ又は２つ（好ましくは１つ）の水素原子が上記C_{3-7}シクロアルキル基で置換されてなる基を意味する。C_{3-7}シクロアルキルアミノ基としては、例えば、シクロブチルアミノ基、シクロペンチルアミノ基、シクロヘキシルアミノ基が挙げられ、好ましくは前記シクロアルキル基の炭素数が３～６であるC_{3-6}シクロアルキルアミノ基であり、より好ましくはシクロブチルアミノ基、シクロペンチルアミノ基である。

【００３２】

一般式（１）中、C_{1-6}アシルアミノ基とは、上記C_{1-6}アルキル基（これを次式：Ｒ－で示す）を１つ有するアミド基（次式：Ｒ－ＣＯ－ＮＨ－で示される基）を意味する。C_{1-6}アシルアミノ基としては、例えば、アセトアミド基、プロピオニルアミノ基、ブチリルアミノ基、イソブチリルアミノ基、バレリルアミノ基、イソバレリルアミノ基

が挙げられ、好ましくは前記アルキル基の炭素数が１～３であるC_{1-3}アシルアミノ基であり、より好ましくはアセトアミド基、プロピオニルアミノ基、ブチリルアミノ基、イソブチリルアミノ基である。

【００３３】

一般式（１）中、C_{1-6}アルキルオキシ基とは、酸素原子に上記C_{1-6}アルキル基が１つ結合してなる基を意味する。C_{1-6}アルキルオキシ基としては、例えば、メトキシ基、エトキシ基、ｎ－プロポキシ基、イソプロポキシ基、ｎ－ブトキシ基、イソブトキシ基、ｔｅｒｔ－ブトキシ基、ｎ－ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ｔｅｒｔ－ペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、（３－メチルブタン－２－イル）オキシ基、ｎ－ヘキシルオキシ基、（４－メチルペンチル）オキシ基、３，３－ジメチルブトキシ基、（２－メチルペンタン－２－イル）オキシ基、（２，３－ジメチルブタン－２－イル）オキシ基、（３，３－ジメチルブタン－２－イル）オキシ基が挙げられ、好ましくは前記アルキル基の炭素数が１～５であるC_{1-5}アルキルオキシ基であり、より好ましくはメトキシ基、エトキシ基、ｎ－プロポキシ基、イソプロポキシ基、ｎ－ブトキシ基、イソブトキシ基、ｎ－ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ｔｅｒｔ－ペンチルオキシ基、（３－メチルブタン－２－イル）オキシ基である。

【００３４】

一般式（１）中、C_{2-6}アルケニルオキシ基とは、酸素原子に炭素数２～６の不飽和炭化水素基が１つ結合してなる基を意味する。C_{2-6}アルケニルオキシ基としては、例えば、ビニルオキシ基、アリルオキシ基、イソプロペニルオキシ基が挙げられ、好ましくは前記不飽和炭化水素基の炭素数が２～３であるC_{2-3}アルケニルオキシ基であり、より好ましくはアリルオキシ基である。

【００３５】

一般式（１）中、C_{1-6}アルキルオキシC_{1-6}アルキル基とは、上記C_{1-6}アルキル基の１つ又は複数（好ましくは１つ）の水素原子が上記C_{1-6}アルキルオキシ基で置換されてなる基を意味する。C_{1-6}アルキルオキシC_{1-6}アルキル基としては、例えば、メトキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシメチル基、エトキシエチル基、ｎ－プロポキシメチル基、ｎ－プロポキシエチル基、イソプロポキシメチル基、イソプロポキシエチル基、ｎ－ブトキシメチル基、イソブトキシメチル基、ｎ－ペンチルオキシメチル基、ｎ－ヘキシルオキシメチル基、が挙げられ、好ましくは前記アルキル基の炭素数が１～３、前記アルキルオキシ基の炭素数が１～５であるC_{1-5}アルキルオキシC_{1-3}アルキル基であり、より好ましくはメトキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシメチル基、エトキシエチル基、ｎ－プロポキシメチル基、イソプロポキシメチル基、ｎ－ブトキシメチル基、イソブトキシメチル基である。

【００３６】

一般式（１）中、C_{3-7}シクロアルキルオキシ基とは、酸素原子に上記C_{3-7}シクロアルキル基が１つ結合してなる基を意味する。C_{3-7}シクロアルキルオキシ基としては、例えば、シクロプロピルオキシ基、シクロブチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基が挙げられ、好ましくは前記シクロアルキル基の炭素数が３～６であるC_{3-6}シクロアルキルオキシ基であり、より好ましくはシクロプロピルオキシ基、シクロブチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基である。

【００３７】

一般式（１）中、C_{6-10}単環若しくは多環式アリールオキシ基とは、酸素原子に上記C_{6-10}単環若しくは多環式アリール基が１つ結合してなる基を意味する。C_{6-10}単環若しくは多環式アリールオキシ基としては、例えば、フェニルオキシ基、ナフチルオキシ基が挙げられ、好ましくは単環であり、より好ましくはフェニルオキシ基である。

【００３８】

一般式（１）中、C_{7-11}単環若しくは多環式アラルキルオキシ基とは、酸素原子に上記C_{7-11}単環若しくは多環式アラルキル基が１つ結合してなる基を意味する。C_{7-11}単環若しくは多環式アラルキルオキシ基としては、例えば、ベンジルオキシ基、ナ

フチルメチルオキシ基が挙げられ、好ましくは単環であり、より好ましくはベンジルオキシ基である。

【００３９】

一般式（１）中、４～１０員の単環若しくは二環式芳香族性複素環オキシ基とは、酸素原子に上記４～１０員の単環若しくは二環式芳香族性複素環基が１つ結合してなる基を意味する。４～１０員の単環若しくは二環式芳香族性複素環オキシ基としては、例えば、チアゾリルオキシ基、オキサゾリルオキシ基、ピリジルオキシ基、ピリミジニルオキシ基、ピラジニルオキシ基、ピリダジニルオキシ基が挙げられ、好ましくは単環であり、より好ましくはピリジルオキシ基、ピリミジニルオキシ基、ピラジニルオキシ基、ピリダジニルオキシ基である。

【００４０】

一般式（１）中、４～１０員の単環若しくは二環式非芳香族性複素環オキシ基とは、酸素原子に上記４～１０員の単環若しくは二環式非芳香族性複素環基でが１つ結合してなる基を意味する。４～１０員の単環若しくは二環式非芳香族性複素環オキシ基としては、例えば、オキセタニルオキシ基、テトラヒドロフラニルオキシ基、テトラヒドロピラニルオキシ基、１,１－ジオキシドテトラヒドロ－２Ｈ－チオピラン－４－イルオキシ基が挙げられ、好ましくは単環であり、より好ましくはオキセタニルオキシ基、テトラヒドロフラニルオキシ基、テトラヒドロピラニルオキシ基、１,１－ジオキシドテトラヒドロ－２Ｈ－チオピラン－４－イルオキシ基である。

【００４１】

一般式（１）中、C_{1-6}アルキルチオ基とは、硫黄原子に上記C_{1-6}アルキル基が１つ結合してなる基を意味する。C_{1-6}アルキルチオ基としては、例えば、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基が挙げられ、好ましくは前記アルキル基の炭素数が１～３であるC_{1-3}アルキルチオ基であり、より好ましくはメチルチオ基、エチルチオ基である。

【００４２】

一般式（１）中、C_{1-6}アルキルスルホニル基とは、上記C_{1-6}アルキル基（これを次式：Ｒ－で示す）を有するスルホニル基（次式：Ｒ－SO_2－で示される基）を意味する。C_{1-6}アルキルスルホニル基としては、例えば、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基が挙げられ、好ましくは前記アルキル基の炭素数が１～３であるC_{1-3}アルキルスルホニル基であり、より好ましくはメチルスルホニル基、エチルスルホニル基である。

【００４３】

一般式（１）中、C_{1-6}アルキルスルフィニル基とは、上記C_{1-6}アルキル基（これを次式：Ｒ－で示す）を有するスルフィニル基（次式：Ｒ－ＳＯ－で示される基）を意味する。C_{1-6}アルキルスルフィニル基としては、例えば、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、プロピルスルフィニル基が挙げられ、好ましくは前記アルキル基の炭素数が１～３であるC_{1-3}アルキルスルフィニル基であり、より好ましくはメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基である。

【００４４】

一般式（１）中、モノC_{1-6}アルキルスルファモイル基とは、スルファモイル基の１つの水素原子が上記C_{1-6}アルキル基（これを次式：Ｒ－で示す）で置換されてなる基（次式：Ｒ－ＮＨ－SO_2－で示される基）を意味する。モノC_{1-6}アルキルスルファモイル基としては、例えば、メチルスルファモイル基、エチルスルファモイル基、プロピルスルファモイル基が挙げられ、好ましくは前記アルキル基の炭素数が１～３であるモノC_{1-3}アルキルスルファモイル基であり、より好ましくはメチルスルファモイル基である。

【００４５】

一般式（１）中、ジC_{1-6}アルキルスルファモイル基とは、スルファモイル基の２つの水素原子が上記C_{1-6}アルキル基（これらを次式：Ｒ－及びＲ’－で示す）で置換さ

れてなる基（次式：Ｒ－ＮＲ’－ＳＯ$_2$－で示される基）を意味する。ジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基としては、例えば、ジメチルスルファモイル基、ジエチルスルファモイル基、ジプロピルスルファモイル基、メチルエチルスルファモイル基が挙げられ、好ましくは前記アルキル基の炭素数が１～３であるジＣ$_{1-3}$アルキルスルファモイル基であり、より好ましくはジメチルスルファモイル基である。本発明に係るジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基としては、ジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基内の２つのＣ$_{1-6}$アルキル基（Ｒ、Ｒ’）が、その置換基と隣接する窒素原子と一体となってピロリジン－１－イル基又はモルホリノ基を形成していてもよい。

【００４６】

一般式（１）中、Ｃ$_{1-6}$アルキルカルボニル基とは、カルボニル基に１つの上記Ｃ$_{1-6}$アルキル基が結合してなる基を意味する。Ｃ$_{1-6}$アルキルカルボニル基としては、例えば、アセチル基、エチルカルボニル基、プロピルカルボニル基、ブチルカルボニル基が挙げられ、好ましくは前記アルキル基の炭素数が１～３であるＣ$_{1-3}$アルキルカルボニル基であり、より好ましくはアセチル基である。

【００４７】

一般式（１）中、１－（Ｃ$_{1-6}$アルキルオキシ）イミノＣ$_{1-6}$アルキル基とは、イミノ基に上記Ｃ$_{1-6}$アルキル基（次式：－Ｒで示す）が結合してなるイミノＣ$_{1-6}$アルキル基（次式：－Ｃ（－Ｒ）＝ＮＨで示す）の窒素原子に結合する１つの水素原子が上記Ｃ$_{1-6}$アルキルオキシ基（次式：－ＯＲ’で示す）で置換されてなる基（次式：－Ｃ（－Ｒ）＝Ｎ－ＯＲ’で示す）を意味する。１－（Ｃ$_{1-6}$アルキルオキシ）イミノＣ$_{1-6}$アルキル基としては、例えば、１－（メトキシ）イミノエチル基、１－（エトキシ）イミノエチル基、１－（メトキシ）イミノプロピル基が挙げられ、好ましくは前記アルキル基の炭素数が１～３である１－（Ｃ$_{1-3}$アルキルオキシ）イミノＣ$_{1-3}$アルキル基であり、より好ましくは１－（メトキシ）イミノエチル基である。

【００４８】

一般式（１）中、モノＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基とは、アミノカルボニル基の１つの水素原子が上記Ｃ$_{1-6}$アルキル基で置換されてなる基を意味する。モノＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基としては、例えば、メチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、プロピルアミノカルボニル基が挙げられ、好ましくは前記アルキル基の炭素数が１～３であるモノＣ$_{1-3}$アルキルアミノカルボニル基であり、より好ましくはメチルアミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基である。

【００４９】

一般式（１）中、ジＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基とは、アミノカルボニル基の２つの水素原子が上記Ｃ$_{1-6}$アルキル基で置換されてなる基を意味する。ジＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基としては、例えば、ジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基、ジプロピルアミノカルボニル基が挙げられ、好ましくは前記アルキル基の炭素数が１～３であるジＣ$_{1-3}$アルキルアミノカルボニル基であり、より好ましくはジメチルアミノカルボニル基、ジエチルアミノカルボニル基である。

【００５０】

一般式（１）中、Ｃ$_{3-7}$シクロアルキルアミノカルボニル基とは、アミノカルボニル基の１つ又は２つ（好ましくは１つ）の水素原子が上記Ｃ$_{3-7}$シクロアルキル基で置換されてなる基を意味する。Ｃ$_{3-7}$シクロアルキルアミノカルボニル基としては、例えば、シクロブチルアミノカルボニル基、シクロペンチルアミノカルボニル基、シクロヘキシルアミノカルボニル基が挙げられ、好ましくは前記シクロアルキル基の炭素数が４～６であるＣ$_{4-6}$シクロアルキルアミノカルボニル基であり、より好ましくはシクロブチルアミノカルボニル基、シクロヘキシルアミノカルボニル基である。

【００５１】

一般式（１）中、Ｃ$_{7-11}$単環若しくは多環式アラルキルアミノカルボニル基とは、アミノカルボニル基の１つ又は２つ（好ましくは１つ）の水素原子が上記Ｃ$_{7-11}$単環若しくは多環式アラルキル基で置換されてなる基を意味する。Ｃ$_{7-11}$単環若しくは多

環式アラルキルアミノカルボニル基としては、単環が好ましく、例えば、ベンジルアミノカルボニル基である。

【００５２】

一般式（１）中、C_{1-6}アルキルオキシカルボニル基とは、カルボニル基に１つの上記C_{1-6}アルキルオキシ基が結合してなる基を意味する。C_{1-6}アルキルオキシカルボニル基としては、例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基が挙げられ、好ましくは前記アルキルオキシ基の炭素数が１～３であるC_{1-3}アルキルオキシカルボニル基であり、より好ましくはメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基である。

【００５３】

一般式（１）中、ヒドロキシアミノカルボニル基とは、アミノカルボニル基の１つ又は２つ（好ましくは１つ）の水素原子が水酸基で置換されてなる基を意味する。

【００５４】

一般式（１）中、「置換されていてもよい」とは、各々の基が１個以上の置換基でさらに置換されていてもよいことをいう。置換されている場合の置換基としては、それぞれの基に置換可能な基であればいずれでもよく、例えば、ハロゲン原子；カルボキシ基；シアノ基；水酸基；１つ以上のハロゲン原子で置換されていてもよいC_{1-6}アルキル基；酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環基で置換されていてもよいC_{2-6}アルケニル基；C_{3-6}シクロアルキル基；ヒドロキシC_{1-6}アルキル基；１つ以上のハロゲン原子で置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシ基；カルバモイル基；アミノカルボニル基；C_{1-6}アルキルカルボニル基；オキソ基；ニトロ基；１つ以上の水酸基で置換されていてもよいモノC_{1-6}アルキルアミノ基；１つ以上の水酸基で置換されていてもよいジC_{1-6}アルキルアミノ基；C_{1-6}アルキルチオ基；C_{1-6}アルキルスルホニル基；C_{6-10}アリール基（単環又は多環（好ましくは単環））；並びに；酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式複素環基（芳香族性又は非芳香族性、C_{1-6}アルキル基又は水酸基で置換されていてもよい）が挙げられる。なお、ヒドロキシC_{1-6}アルキル基とは、上記C_{1-6}アルキル基の１つ又は複数（好ましくは１つ）の水素原子が水酸基で置換されてなる基を意味し、例えば、ヒドロキシメチル基、１－ヒドロキシエチル基、２－ヒドロキシプロパン－２－イル基が挙げられる。

【００５５】

前記置換基がハロゲン原子である場合、例えば、フッ素原子で置換されたC_{1-6}アルキル基としては、トリフルオロメチル基、トリフルオロエチル基、ジフルオロメチル基、ジフルオロエチル基などが挙げられ、フッ素原子で置換されたC_{1-6}アルキルオキシ基としては、トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロエトキシ基などが挙げられ、フッ素原子で置換されたC_{1-6}アルキルオキシC_{1-6}アルキル基としては、２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル基、１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル基などが挙げられる。

【００５６】

また、前記置換基が水酸基である場合、例えば、水酸基で置換されたC_{1-6}アルキルオキシ基としては、２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、２－ヒドロキシプロポキシ基などが挙げられ、水酸基で置換されたC_{1-6}アルキルチオ基としては、（２－ヒドロキシエチル）チオ基などが挙げられ、水酸基で置換されたC_{1-6}アルキルスルホニル基としては、（２－ヒドロキシエチル）スルホニル基などが挙げられる。

【００５７】

また、前記置換基がハロゲン原子及び水酸基である場合、例えば、フッ素原子及び水酸基で置換されたC_{1-6}アルキルオキシ基としては、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、１，１－ジフルオロ

－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシプロポキシ基などが挙げられ、フッ素原子及び水酸基で置換されたＣ$_{1-6}$アルキル基としては、２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基などが挙げられる。また、フッ素原子及び水酸基で置換されたＣ$_{1-6}$アルキルオキシＣ$_{1-6}$アルキル基としては、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基などが挙げられる。

【００５８】

また、前記置換基がハロゲン原子及びシアノ基である場合、例えば、フッ素原子及びシアノ基で置換されたＣ$_{1-6}$アルキルオキシＣ$_{1-6}$アルキル基としては、１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基などが挙げられる。

【００５９】

また、前記置換基がオキソ基である場合、例えば、オキソ基で置換されたテトラヒドロ－２Ｈ－チオピラニル基としては、１，１－ジオキシドテトラヒドロ－２Ｈ－チオピラニル基などが挙げられる。

【００６０】

本発明において、一般式（１）中、Ｒ^{1}及びＲ^{2}が示す基は、同一でも異なっていてもよく、それぞれ、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキル基、置換されていてもよいＣ$_{6-10}$単環若しくは多環式アリール基、置換されていてもよいＣ$_{7-11}$単環若しくは多環式アラルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式芳香族性複素環基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式非芳香族性複素環基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルアミノ基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルアミノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アシルアミノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{2-6}$アルケニルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{6-10}$単環若しくは多環式アリールオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{7-11}$単環若しくは多環式アラルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルチオ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルホニル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基［ジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基内の２つのＣ$_{1-6}$アルキル基は隣接する窒素原子と一体となってピロリジン－１－イル基又はモルホリノ基を形成してもよい］、スルファモイル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルカルボニル基、置換されていてもよい１－（Ｃ$_{1-6}$アルキルオキシ）イミノＣ$_{1-6}$アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{7-11}$単環若しくは多環式アラルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシカルボニル基、又は置換されていてもよいヒドロキシアミノカルボニル基である。

【００６１】

本発明において、一般式（１）中、Ｒ^{1}が示す基として好ましくは、水素原子、フッ素

原子、塩素原子、カルボキシ基、シアノ基、メチル基、エチル基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、モルホリノメチル基、（ジメチルアミノ）メチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル基、１－ヒドロキシエチル基、１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－２－メチルプロピル基、１－メトキシエチル基、２－メトキシプロパン－２－イル基、１－アセトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル基、１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル基、１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（カルボキシメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（２－アミノ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（メチルスルホニル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（スルファモイルメトキシ）エチル基、１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１，１，４，４，４－ヘキサフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル基、１－（（１，３－ジヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－３－オキソブタン－２－イル基、１，１，１，４，４，４－ヘキサフルオロ－３－オキソブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－３，４－ジヒドロキシブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－４－ヒドロキシ－３－オキソブタン－２－イル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２－ジフルオロエチル基、１－ヒドロキシ－３－（メチルスルホニル）プロピル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－３－（メチルスルホニル）プロピル基、３－（エチルスルホニル）－１－ヒドロキシプロピル基、３－（エチルスルホニル）－２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－（イソプロピルスルホニル）プロピル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－３－（イソプロピルスルホニル）プロピル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－モルホリノ－２－オキソエトキシ）エチル基、１－ヒドロキシ－２－モルホリノエチル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－モルホリノエチル基、１－カルボキシ－２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、１－カルボキシ－２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－１－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシ－１－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）エチル基、１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブタン－２－イル基、３－シアノ－１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，３－ジヒドロキシプロ

ピル基、１－ヒドロキシ－３－メトキシプロピル基、４，４，４－トリフルオロ－１，３－ジヒドロキシブチル基、１，３－ジヒドロキシブチル基、１，３－ジヒドロキシ－３－メチルブチル基、シクロプロピル（ヒドロキシ）メチル基、カルボキシ（ヒドロキシ）メチル基、ヒドロキシ（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メチル基、ヒドロキシ（３－ヒドロキシシクロブチル）メチル基、３－アミノ－１－ヒドロキシ－３－オキソプロピル基、１－ヒドロキシ－２－（メチルスルホンアミド）エチル基、２－シアノエチル基、１，２－ジヒドロキシエチル基、３，３，３－トリフルオロ－１，２－ジヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－１－ヒドロキシ－２－オキソプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－１－ヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－２－オキソプロピル基、１－ヒドロキシ－３－オキソブチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、フェニル基、ベンジル基、チアゾール－２－イル基、１Ｈ－ピラゾール－１－イル基、５－メチルチアゾール－２－イル基、５－メトキシカルボニルチアゾール－２－イル基、５－ヒドロキシメチルチアゾール－２－イル基、５－（１－ヒドロキシエチル）チアゾール－２－イル基、５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－イル基、５－（Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノメチル）チアゾール－２－イル基、５－メチルチアゾール－４－イル基、オキサゾール－２－イル基、オキサゾール－４－イル基、５－メチルオキサゾール－４－イル基、１Ｈ－イミダゾール－１－イル基、２，５－ジメチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル基、１Ｈ－イミダゾール－４－イル基、１－メチル－１Ｈ－イミダゾール－２－イル基、１－メチル－１Ｈ－イミダゾール－４－イル基、ピリジン－２－イル基、ピリジン－３－イル基、ピリジン－４－イル基、３，５－ジメチルピリジン－４－イル基、６－ヒドロキシピリジン－２－イル基、５－ヒドロキシピリジン－２－イル基、４－ヒドロキシピリジン－２－イル基、３－ヒドロキシピリジン－２－イル基、６－メトキシピリジン－２－イル基、５－メトキシピリジン－２－イル基、４－メトキシピリジン－２－イル基、３－メトキシピリジン－２－イル基、ピリミジン－２－イル基、ピリミジン－４－イル基、１，３，５－トリアジン－２－イル基、テトラヒドロフラン－２－イル基、テトラヒドロフラン－３－イル基、テトラヒドロピラン－２－イル基、テトラヒドロピラン－３－イル基、テトラヒドロピラン－４－イル基、オキセタニル基、ピロリジン－１－イル基、ピペリジン－１－イル基、ピペラジン－１－イル基、モルホリン－４－イル基、アゼチジン－１－イル基、４－ヒドロキシピペリジン－１－イル基、３－ヒドロキシピロリジン－１－イル基、３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、メチルエチルアミノ基、シクロブチルアミノ基、シクロペンチルアミノ基、シクロヘキシルアミノ基、アセトアミド基、Ｎ－メチルアセトアミド基、プロピオニルアミノ基、ブチリルアミノ基、イソブチリルアミノ基、バレリルアミノ基、イソバレリルアミノ基、メトキシ基、エトキシ基、ｎ－プロポキシ基、イソプロポキシ基、ｎ－ブトキシ基、イソブトキシ基、トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、２，２，２－トリフルオロエトキシ基、シアノメトキシ基、カルボキシメトキシ基、２－ヒドロキシエトキシ基、２－メトキシエトキシ基、２－ヒドロキシプロポキシ基、２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、２，２－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、２－（トリフルオロメトキシ）エトキシ基、（１，３－ジヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ基、（１－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメトキシ）プロパン－２－イル）オキシ基、２－オキソプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－オキソプロポキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－オキソブタン－２－イル）オキシ基、３，３，３－トリフルオロ－２－オキソプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル）オキシ基、オキセタン－３－イルメトキシ基、３－ヒドロキシ－２－（ヒドロキシメチル）プロポキシ基、アリルオキシ基、シ

クロブトキシ基、（メチルスルホニル）メトキシ基、（エチルスルホニル）メトキシ基、（イソプロピルスルホニル）メトキシ基、（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ基、２－アミノ－２－オキソエトキシ基、シアノジフルオロメトキシ基、カルボキシジフルオロメトキシ基、ジフルオロ（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ基、ジフルオロ（メチルスルホニル）メトキシ基、２－カルボキシエトキシ基、２－シアノエトキシ基、２－（メチルスルホニル）エトキシ基、２－モルホリノエトキシ基、３－ヒドロキシシクロブトキシ基、３－シアノシクロブトキシ基、３－カルボキシシクロブトキシ基、３－（メチルスルホニル）シクロブトキシ基、３－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）シクロブトキシ基、（４－ヒドロキシシクロヘキシル）オキシ基、２－ヒドロキシ－３－メトキシプロポキシ基、フェニルオキシ基、ベンジルオキシ基、チアゾール－５－イルオキシ基、チアゾール－４－イルオキシ基、ピリジン－４－イルオキシ基、ピリジン－３－イルオキシ基、メチルチオ基、メチルスルホニル基、メチルスルフィニル基、メチルスルファモイル基、ジメチルスルファモイル基、スルファモイル基、アセチル基、２，２－ジフルオロアセチル基、１－（メトキシイミノ）エチル基、カルバモイル基、ジメチルカルバモイル基、モルホリン－４－カルボニル基、ピペリジン－１－カルボニル基、アゼチジン－１－カルボニル基、ベンジルカルバモイル基、メチルカルバモイル基、３－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）アゼチジン－１－カルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル）オキシ基、３－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）シクロブトキシ基、（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（３－ヒドロキシ－２，３－ジメチルブタン－２－イル）オキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－メトキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基、１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブトキシ基、（１，１－ジオキシドテトラヒドロ－２Ｈ－チオピラン－４－イル）オキシ）基、オキセタン－３－イルオキシ基、１，１－ジフルオロ－２，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、（トリフルオロメチル）スルホニル基、（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、ピリジン－２－イルオキシ基、ピリミジン－２－イルオキシ基、ピラジン－２－イルオキシ基、（６－メチル－４－（トリフルオロメチル）ピリダジン－３－イル）オキシ基、（５－（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、（５－（ヒドロキシメチル）－３－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、（５－（トリフルオロメトキシ）ピリジン－２－イル）オキシ基、（２－ヒドロキシエチル）チオ基、（２－ヒドロキシエチル）スルフィニル基、（２－ヒドロキシエチル）スルホニル基、（１，１－ジフルオロアリル）オキシ基、（５－（メチルスルホニル）ピリジン－２－イル）オキシ基、（２－メトキシエチル）カルバモイル基、（２－ヒドロキシエチル）カルバモイル基、（２－ヒドロキシエチル）（メチル）カルバモイル基、シクロプロピルカルバモイル基、エチルカルバモイル基、ピロリジン－１－カルボニル基、ヒドロキシカルバモイル基、１，１－ジフルオロ－２，３－ジヒドロキシプロポキシ基、３－（（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、１，１－ジフルオロ－２，２－ジヒドロキシプロポキシ基、Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）スルファモイル基、Ｎ－（２－メトキシエチル）スルファモイル基、Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルスルファモイル基、ピロリジン－１－イルスルホニル基、モルホリノスルホニル基、１，１－ジフルオロ－２－メトキシエトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－メトキシ－２－メチルプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシブトキシ基、１，１－ジオキシドチオモルホリノ基、１，１－ジフルオロプロポキシ基、又は１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－３－メチルブトキシ基であり、より好ましくは、水素原子、塩素原子、カルボキシ基、メチル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプ

ロパン－２－イル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル基、１－ヒドロキシエチル基、１－メトキシエチル基、２－メトキシプロパン－２－イル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル基、１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル基、１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（カルボキシメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（２－アミノ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（メチルスルホニル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（スルファモイルメトキシ）エチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２－ジフルオロエチル基、１－ヒドロキシ－３－（メチルスルホニル）プロピル基、３－（エチルスルホニル）－１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－（イソプロピルスルホニル）プロピル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－モルホリノ－２－オキソエトキシ）エチル基、１－カルボキシ－２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－１－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）エチル基、フェニル基、チアゾール－２－イル基、アセトアミド基、メトキシ基、トリフルオロメトキシ基、シアノメトキシ基、カルボキシメトキシ基、２－ヒドロキシエトキシ基、２－メトキシエトキシ基、２－ヒドロキシプロポキシ基、２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、２，２－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、２－（トリフルオロメトキシ）エトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル）オキシ基、シクロブトキシ基、（メチルスルホニル）メトキシ基、（エチルスルホニル）メトキシ基、（イソプロピルスルホニル）メトキシ基、（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ基、２－アミノ－２－オキソエトキシ基、カルボキシジフルオロメトキシ基、２－カルボキシエトキシ基、２－シアノエトキシ基、２－（メチルスルホニル）エトキシ基、２－モルホリノエトキシ基、３－ヒドロキシシクロブトキシ基、３－シアノシクロブトキシ基、３－カルボキシシクロブトキシ基、３－（メチルスルホニル）シクロブトキシ基、３－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）シクロブトキシ基、（４－ヒドロキシシクロヘキシル）オキシ基、２－ヒドロキシ－３－メトキシプロポキシ基、ベンジルオキシ基、アセチル基、カルバモイル基、ジメチルカルバモイル基、モルホリン－４－カルボニル基、ピペリジン－１－カルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル）オキシ基、ジフルオロメトキシ基、３－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）シクロブトキシ基、（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ基

、２，２，２－トリフルオロ－１－（（３－ヒドロキシ－２，３－ジメチルブタン－２－イル）オキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－メトキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基、１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブトキシ基、（１，１－ジオキシドテトラヒドロ－２Ｈ－チオピラン－４－イル）オキシ）基、オキセタン－３－イルオキシ基、１，１－ジフルオロ－２，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、（トリフルオロメチル）スルホニル基、（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、ピリジン－２－イルオキシ基、ピリミジン－２－イルオキシ基、ピラジン－２－イルオキシ基、（６－メチル－４－（トリフルオロメチル）ピリダジン－３－イル）オキシ基、（５－（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、（５－（ヒドロキシメチル）－３－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、（５－（トリフルオロメトキシ）ピリジン－２－イル）オキシ基、メチルスルホニル基、シクロプロピル基、メチルチオ基、メチルスルフィニル基、（２－ヒドロキシエチル）チオ基、（２－ヒドロキシエチル）スルフィニル基、（２－ヒドロキシエチル）スルホニル基、（１，１－ジフルオロアリル）オキシ基、（５－（メチルスルホニル）ピリジン－２－イル）オキシ基、（２－メトキシエチル）カルバモイル基、（２－ヒドロキシエチル）カルバモイル基、（２－ヒドロキシエチル）（メチル）カルバモイル基、シクロプロピルカルバモイル基、エチルカルバモイル基、ピロリジン－１－カルボニル基、ベンジルカルバモイル基、ヒドロキシカルバモイル基、１，１－ジフルオロ－２，３－ジヒドロキシプロポキシ基、３－（（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、１，１－ジフルオロ－２，２－ジヒドロキシプロポキシ基、Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）スルファモイル基、Ｎ－（２－メトキシエチル）スルファモイル基、Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルスルファモイル基、ピロリジン－１－イルスルホニル基、モルホリノスルホニル基、１，１－ジフルオロ－２－メトキシエトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－メトキシ－２－メチルプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシブトキシ基、１，１－ジオキシドチオモルホリノ基、１，１－ジフルオロプロポキシ基、又は１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－３－メチルブトキシ基である。

【００６２】

一般式（１）中、R^2が示す基として好ましくは、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、カルボキシ基、シアノ基、メチル基、エチル基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、モルホリノメチル基、（ジメチルアミノ）メチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル基、１－ヒドロキシエチル基、１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－２－メチルプロピル基、１－メトキシエチル基、２－メトキシプロパン－２－イル基、１－アセトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル基、１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル基、１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（１，１－ジフ

ルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（カルボキシメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（２－アミノ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（メチルスルホニル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（スルファモイルメトキシ）エチル基、１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１，１，４，４，４－ヘキサフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル基、１－（（１，３－ジヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－３－オキソブタン－２－イル基、１，１，１，４，４，４－ヘキサフルオロ－３－オキソブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－３，４－ジヒドロキシブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－４－ヒドロキシ－３－オキソブタン－２－イル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２－ジフルオロエチル基、１－ヒドロキシ－３－（メチルスルホニル）プロピル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－３－（メチルスルホニル）プロピル基、３－（エチルスルホニル）－１－ヒドロキシプロピル基、３－（エチルスルホニル）－２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－（イソプロピルスルホニル）プロピル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－３－（イソプロピルスルホニル）プロピル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－モルホリノ－２－オキソエトキシ）エチル基、１－ヒドロキシ－２－モルホリノエチル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－モルホリノエチル基、１－カルボキシ－２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、１－カルボキシ－２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－１－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシ－１－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）エチル基、１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブタン－２－イル基、３－シアノ－１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，３－ジヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－メトキシプロピル基、４，４，４－トリフルオロ－１，３－ジヒドロキシブチル基、１，３－ジヒドロキシブチル基、１，３－ジヒドロキシ－３－メチルブチル基、シクロプロピル（ヒドロキシ）メチル基、カルボキシ（ヒドロキシ）メチル基、ヒドロキシ（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メチル基、ヒドロキシ（３－ヒドロキシシクロブチル）メチル基、３－アミノ－１－ヒドロキシ－３－オキソプロピル基、１－ヒドロキシ－２－（メチルスルホンアミド）エチル基、２－シアノエチル基、１，２－ジヒドロキシエチル基、３，３，３－トリフルオロ－１，２－ジヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－１－ヒドロキシ－２－オキソプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－１－ヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－２－オキソプロピル基、１－ヒドロキシ－３－オキソブチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、フェニル基、ベンジル基、チアゾール－２－イル基、１Ｈ－ピラゾール－１－イル基、５－メチルチアゾール－２－イル基、５－メトキシカルボニルチアゾール－２－イル基、５－ヒドロキシメチルチアゾール－２－イル基、５－（１－ヒドロキシエチル）チアゾール－２－イル基、５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－イル基、５－（Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノメチル）チアゾール－２－イル基、５－メチルチアゾール－４－イル基、オキサゾール－２－イル基、オキサゾール－４－イル基、５－メチルオキサゾール－４－イル基、１Ｈ－イミダゾール－１－イル基、２，５－ジメチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル基、１Ｈ－イミダゾール－４－イル基、１－メチル－１Ｈ－イミダゾール－２－イル基、１－メチル－１Ｈ－イミダゾール－４－イル基、ピリジン－２－イル基、ピリジン－３－イル基、ピリジン－４－イル基、３，５－ジメチルピリジン－４－イル基、６－ヒドロキシ

ピリジン－２－イル基、５－ヒドロキシピリジン－２－イル基、４－ヒドロキシピリジン－２－イル基、３－ヒドロキシピリジン－２－イル基、６－メトキシピリジン－２－イル基、５－メトキシピリジン－２－イル基、４－メトキシピリジン－２－イル基、３－メトキシピリジン－２－イル基、ピリミジン－２－イル基、ピリミジン－４－イル基、１，３，５－トリアジン－２－イル基、テトラヒドロフラン－２－イル基、テトラヒドロフラン－３－イル基、テトラヒドロピラン－２－イル基、テトラヒドロピラン－３－イル基、テトラヒドロピラン－４－イル基、オキセタニル基、ピロリジン－１－イル基、ピペリジン－１－イル基、ピペラジン－１－イル基、モルホリン－４－イル基、アゼチジン－１－イル基、４－ヒドロキシピペリジン－１－イル基、３－ヒドロキシピロリジン－１－イル基、３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、メチルエチルアミノ基、シクロブチルアミノ基、シクロペンチルアミノ基、シクロヘキシルアミノ基、アセトアミド基、Ｎ－メチルアセトアミド基、プロピオニルアミノ基、ブチリルアミノ基、イソブチリルアミノ基、バレリルアミノ基、イソバレリルアミノ基、メトキシ基、エトキシ基、ｎ－プロポキシ基、イソプロポキシ基、ｎ－ブトキシ基、イソブトキシ基、トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、２，２，２－トリフルオロエトキシ基、シアノメトキシ基、カルボキシメトキシ基、２－ヒドロキシエトキシ基、２－メトキシエトキシ基、２－ヒドロキシプロポキシ基、２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、２，２－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、２－（トリフルオロメトキシ）エトキシ基、（１，３－ジヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ基、（１－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメトキシ）プロパン－２－イル）オキシ基、２－オキソプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－オキソプロポキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－オキソブタン－２－イル）オキシ基、３，３，３－トリフルオロ－２－オキソプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル）オキシ基、オキセタン－３－イルメトキシ基、３－ヒドロキシ－２－（ヒドロキシメチル）プロポキシ基、アリルオキシ基、シクロブトキシ基、（メチルスルホニル）メトキシ基、（エチルスルホニル）メトキシ基、（イソプロピルスルホニル）メトキシ基、（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ基、２－アミノ－２－オキソエトキシ基、シアノジフルオロメトキシ基、カルボキシジフルオロメトキシ基、ジフルオロ（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ基、ジフルオロ（メチルスルホニル）メトキシ基、２－カルボキシエトキシ基、２－シアノエトキシ基、２－（メチルスルホニル）エトキシ基、２－モルホリノエトキシ基、３－ヒドロキシシクロブトキシ基、３－シアノシクロブトキシ基、３－カルボキシシクロブトキシ基、３－（メチルスルホニル）シクロブトキシ基、３－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）シクロブトキシ基、（４－ヒドロキシシクロヘキシル）オキシ基、２－ヒドロキシ－３－メトキシプロポキシ基、フェニルオキシ基、ベンジルオキシ基、チアゾール－５－イルオキシ基、チアゾール－４－イルオキシ基、ピリジン－４－イルオキシ基、ピリジン－３－イルオキシ基、メチルチオ基、メチルスルホニル基、メチルスルフィニル基、メチルスルファモイル基、ジメチルスルファモイル基、スルファモイル基、アセチル基、２，２－ジフルオロアセチル基、１－（メトキシイミノ）エチル基、カルバモイル基、ジメチルカルバモイル基、モルホリン－４－カルボニル基、ピペリジン－１－カルボニル基、アゼチジン－１－カルボニル基、ベンジルカルバモイル基、メチルカルバモイル基、３－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）アゼチジン－１－カルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、１－ヒドロキシシクロプロピル基、又は１－メトキシシクロプロピル基であり、より好ましくは、水素原子、塩素原子、カルボキシ基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、モルホリノメチル基、（ジメチルアミノ）メチル基、２，２，２－トリフルオロ－１

－ヒドロキシエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル基、１－ヒドロキシエチル基、１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－２－メチルプロピル基、１－メトキシエチル基、２－メトキシプロパン－２－イル基、１－アセトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル基、１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル基、１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（カルボキシメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（２－アミノ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（メチルスルホニル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（スルファモイルメトキシ）エチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２－ジフルオロエチル基、１－ヒドロキシ－３－（メチルスルホニル）プロピル基、３－（エチルスルホニル）－１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－（イソプロピルスルホニル）プロピル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－モルホリノ－２－オキソエトキシ）エチル基、１－カルボキシ－２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－１－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）エチル基、１，３－ジヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－メトキシプロピル基、４，４，４－トリフルオロ－１，３－ジヒドロキシブチル基、１，３－ジヒドロキシブチル基、１，３－ジヒドロキシ－３－メチルブチル基、カルボキシ（ヒドロキシ）メチル基、ヒドロキシ（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メチル基、ヒドロキシ（３－ヒドロキシシクロブチル）メチル基、１－ヒドロキシ－２－モルホリノエチル基、３－アミノ－１－ヒドロキシ－３－オキソプロピル基、１－ヒドロキシ－２－（メチルスルホンアミド）エチル基、２－シアノエチル基、１，２－ジヒドロキシエチル基、３，３，３－トリフルオロ－１，２－ジヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－１－ヒドロキシ－２－オキソプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－１－ヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－２－オキソプロピル基、１－ヒドロキシ－３－オキソブチル基、アセトアミド基、Ｎ－メチルアセトアミド基、メトキシ基、イソプロポキシ基、トリフルオロメトキシ基、２，２，２－トリフルオロエトキシ基、シアノメトキシ基、カルボキシメトキシ基、２－ヒドロキシエトキシ基、２－メトキシエトキシ基、２－ヒドロキシプロポキシ基、２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、２，２－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、２－（トリフルオロメトキシ）エトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イ

ル）オキシ基、オキセタン－３－イルメトキシ基、３－ヒドロキシ－２－（ヒドロキシメチル）プロポキシ基、アリルオキシ基、シクロブトキシ基、（メチルスルホニル）メトキシ基、（エチルスルホニル）メトキシ基、（イソプロピルスルホニル）メトキシ基、（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ基、２－アミノ－２－オキソエトキシ基、カルボキシジフルオロメトキシ基、２－カルボキシエトキシ基、２－シアノエトキシ基、２－（メチルスルホニル）エトキシ基、２－モルホリノエトキシ基、３－ヒドロキシシクロブトキシ基、３－シアノシクロブトキシ基、３－カルボキシシクロブトキシ基、３－（メチルスルホニル）シクロブトキシ基、３－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）シクロブトキシ基、（４－ヒドロキシシクロヘキシル）オキシ基、２－ヒドロキシ－３－メトキシプロポキシ基、ベンジルオキシ基、メチルチオ基、メチルスルホニル基、メチルスルフィニル基、メチルスルファモイル基、ジメチルスルファモイル基、スルファモイル基、アセチル基、１－（メトキシイミノ）エチル基、カルバモイル基、ジメチルカルバモイル基、モルホリン－４－カルボニル基、ピペリジン－１－カルボニル基、アゼチジン－１－カルボニル基、ベンジルカルバモイル基、メチルカルバモイル基、３－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）アゼチジン－１－カルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、１－ヒドロキシシクロプロピル基、又は１－メトキシシクロプロピル基である。

【００６３】

本発明において、一般式（１）中、R^3が示す基は、水素原子である。

【００６４】

本発明において、一般式（１）中、R^4が示す基は、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式複素環基であり、芳香族性及び非芳香族性のいずれであってもよい。また、R^4が前記置換基で置換されている場合、置換位置はいずれでもよい。一般式（１）中、R^4が示す基として好ましくは、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、クロロチアゾリル基、シアノチアゾリル基、メチルチアゾリル基、ヒドロキシメチルチアゾリル基、カルバモイルチアゾリル基、ニトロチアゾリル基、フルオロチアゾリル基、ジフルオロチアゾリル基、重水素化されたチアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、メチルイミダゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、クロロピリジル基、フルオロピリジル基、シアノピリジル基、メチルピリジル基、ピリミジニル基、テトラゾリル基、又はフラニル基であり、より好ましくは、オキサゾリル基、チアゾリル基、フルオロチアゾリル基、ジフルオロチアゾリル基、重水素化されたチアゾリル基、イソチアゾリル基、ピリジル基、フルオロピリジル基、又はフラニル基であり、さらに好ましくは、チアゾール－２－イル基、チアゾール－４－イル基、ピリジン－２－イル基、オキサゾール－２－イル基、１Ｈ－ピラゾール－１－イル基、４－メチルチアゾール－２－イル基、５－フルオロピリジン－２－イル基、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル基、１，２，４－チアジアゾール－５－イル基、１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル基、ピリミジン－２－イル基、イソチアゾール－３－イル基、３－メチル－１，２，４－チアジアゾール－５－イル基、又は５－クロロピリジン－２－イル基である。

【００６５】

本発明において、一般式（１）中、Ｘは、次式：－CH_2－、－CH_2－CH_2－、－CH_2－CH_2－CH_2－、又は－CH_2－Ｏ－CH_2－で示される基を示す。

【００６６】

本発明において、一般式（１）中、Ｚは水素原子又は水酸基を示す。

【００６７】

本発明に係る化合物又はその薬理的に許容される塩のより好ましい態様としては、例えば、前記一般式（１）で表される化合物が下記の化合物（１ａ）～（１ｊ）である態様が挙げられる。

【００６８】

［化合物（１ａ）］

一般式（１）中、

R^1が示す基が、上記のうち、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環基、置換されていてもよいC_{1-6}アシルアミノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルチオ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルスルホニル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノC_{1-6}アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジC_{1-6}アルキルスルファモイル基［ジC_{1-6}アルキルスルファモイル基内の２つのC_{1-6}アルキル基は隣接する窒素原子と一体となってピロリジン－１－イル基又はモルホリノ基を形成してもよい］、スルファモイル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルカルボニル基、置換されていてもよい１－（C_{1-6}アルキルオキシ）イミノC_{1-6}アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノC_{1-6}アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジC_{1-6}アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいC_{7-11}単環式アラルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシカルボニル基、又は置換されていてもよいヒドロキシアミノカルボニル基であり、

R^2が示す基が、上記のうち、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環基、置換されていてもよいC_{1-6}アシルアミノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシ基、置換されていてもよいC_{2-6}アルケニルオキシ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルチオ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルスルホニル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノC_{1-6}アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジC_{1-6}アルキルスルファモイル基、スルファモイル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルカルボニル基、置換されていてもよい１－（C_{1-6}アルキルオキシ）イミノC_{1-6}アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノC_{1-6}アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジC_{1-6}アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいC_{7-11}単環若しくは多環式アラルキルアミノカルボニル基、又は置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシカルボニル基である、

化合物。

【００６９】

［化合物（１ｂ）］

一般式（１）中、

R^1が示す基が、上記のうち、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロ

アルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アシルアミノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルチオ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルホニル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基［ジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基内の２つのＣ$_{1-6}$アルキル基は隣接する窒素原子と一体となってピロリジン－１－イル基又はモルホリノ基を形成してもよい］、スルファモイル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルカルボニル基、置換されていてもよい１－（Ｃ$_{1-6}$アルキルオキシ）イミノＣ$_{1-6}$アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{7-11}$単環式アラルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシカルボニル基、又は置換されていてもよいヒドロキシアミノカルボニル基であり、

Ｒ^{2}が示す基が、上記のうち水素原子である、

化合物。

【００７０】

［化合物（１ｃ）］

一般式（１）中、

Ｒ^{1}が示す基が、上記のうち水素原子であり、

Ｒ^{2}が示す基が、上記のうち、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アシルアミノ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{2-6}$アルケニルオキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシＣ$_{1-6}$アルキル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルチオ基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルホニル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルスルファモイル基、スルファモイル基、置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルカルボニル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよい１－（Ｃ$_{1-6}$アルキルオキシ）イミノＣ$_{1-6}$アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジＣ$_{1-6}$アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{3-7}$シクロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいＣ$_{7-11}$単環若しくは多環式アラルキルアミノカルボニル基、又は置換されていてもよいＣ$_{1-6}$アルキルオキシカルボニル基である、

化合物。

【００７１】

［化合物（１ｄ）］

一般式（１）中、
R^1が示す基及びR^2が示す基が、同一でも異なっていてもよく、それぞれ、上記のうち、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシ基、シアノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキル基、置換されていてもよいC_{6-10}単環若しくは多環式アリール基、置換されていてもよいC_{7-11}単環若しくは多環式アラルキル基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式芳香族性複素環基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式非芳香族性複素環基、ジC_{1-6}アルキルアミノ基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキルアミノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アシルアミノ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシ基、置換されていてもよいC_{2-6}アルケニルオキシ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシC_{1-6}アルキル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキルオキシ基、置換されていてもよいC_{6-10}単環若しくは多環式アリールオキシ基、置換されていてもよいC_{7-11}単環若しくは多環式アラルキルオキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよい酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選択される１～４個のヘテロ原子を含む４～１０員の単環若しくは二環式非芳香族性複素環オキシ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルチオ基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルスルホニル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルスルフィニル基、置換されていてもよいモノC_{1-6}アルキルスルファモイル基、置換されていてもよいジC_{1-6}アルキルスルファモイル基［ジC_{1-6}アルキルスルファモイル基内の２つのC_{1-6}アルキル基は隣接する窒素原子と一体となってピロリジン－１－イル基又はモルホリノ基を形成してもよい］、スルファモイル基、置換されていてもよいC_{1-6}アルキルカルボニル基、置換されていてもよい１－（C_{1-6}アルキルオキシ）イミノC_{1-6}アルキル基、アミノカルボニル基、置換されていてもよいモノC_{1-6}アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいジC_{1-6}アルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいC_{3-7}シクロアルキルアミノカルボニル基、置換されていてもよいC_{7-11}単環若しくは多環式アラルキルアミノカルボニル基、又は置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシカルボニル基である、
化合物。
【００７２】
［化合物（１ｅ）］
一般式（１）中、
R^1が示す基が、上記のうち、水素原子；ハロゲン原子；水酸基；カルボキシ基；シアノ基；フッ素原子、水酸基、メチル基、メトキシ基、オキソ基、並びに、酸素原子及び窒素原子から選択される１～３個のヘテロ原子を含む４～６員の単環式非芳香族性複素環基、から選択される１つ以上の置換基で置換されていてもよいC_{1-3}アルキル基；C_{3-6}シクロアルキル基；窒素原子及び硫黄原子から選択される１～３個のヘテロ原子を含む４～６員の単環式芳香族性複素環基；酸素原子及び窒素原子から選択される１又は２個のヘテロ原子を含む４～６員の単環式非芳香族性複素環基；C_{1-3}アシルアミノ基；フッ素原子、水酸基、メチル基、エチル基、シアノ基、及びメトキシ基、から選択される１つ以上の置換基で置換されていてもよいC_{1-5}アルキルオキシ基；フッ素原子、水酸基、シアノ基、カルボキシ基、カルバモイル基、メチル基、テトラゾリル基、メトキシ基、及びシクロプロピル基、から選択される１つ以上の置換基で置換されていてもよいC_{1-3}アルキルオキシC_{1-3}アルキル基；水酸基で置換されていてもよいC_{1-3}アルキル基、水酸基、及びシアノ基、から選択される１つ以上の置換基で置換されていてもよいC_{3-6}シクロアルキルオキシ基；水酸基で置換されていてもよいC_{1-3}アルキル基、C_{1-3}アルキル基、トリフルオロメチル基、及びC_{1-3}アルキルスルホニル基、から選択される１つ以上の置換基で置換されていてもよい、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から

選択される１～４個のヘテロ原子を含む５～６員の単環芳香族性複素環オキシ基；酸素原子及び硫黄原子から選択される１～３個のヘテロ原子を含み、硫黄原子を含む場合には硫黄原子に１つ以上のオキソ基が結合していてもよい４～６員の単環式非芳香族性複素環オキシ基；水酸基で置換されていてもよいＣ$_{1-3}$アルキルチオ基；水酸基及びフッ素原子から選択される１つ以上の置換基で置換されていてもよいＣ$_{1-3}$アルキルスルホニル基；水酸基及びフッ素原子から選択される１つ以上の置換基で置換されていてもよいＣ$_{1-3}$アルキルスルフィニル基；スルファモイル基；Ｃ$_{1-3}$アルキルカルボニル基；アミノカルボニル基；水酸基、Ｃ$_{1-3}$アルキルオキシ基、及びフェニル基、から選択される１つ以上の置換基で置換されていてもよいモノＣ$_{1-3}$アルキルアミノカルボニル基；水酸基で置換されていてもよいジＣ$_{1-3}$アルキルアミノカルボニル基；Ｃ$_{3-6}$シクロアルキルアミノ基；Ｃ$_{7-9}$単環式アラルキルアミノカルボニル基；又はＣ$_{1-3}$アルキルオキシカルボニル基であり、

Ｒ^{2}が示す基が、上記のうち、水素原子；ハロゲン原子；水酸基；カルボキシ基；フッ素原子、水酸基、メチル基、メトキシ基、オキソ基、ジメチルアミノ基、並びに、酸素原子及び窒素原子から選択される１～３個のヘテロ原子を含む４～６員の単環式非芳香族性複素環基、から選択される１つ以上の置換基で置換されていてもよいＣ$_{1-3}$アルキル基；Ｃ$_{3-6}$シクロアルキル基；オキソ基で置換されていてもよいジＣ$_{1-3}$アルキルアミノ基；Ｃ$_{1-3}$アシルアミノ基；フッ素原子、水酸基、メチル基、エチル基、シアノ基、メトキシ基、オキセタン－３－イル基、ヒドロキシメチル基、ビニル基、及びカルボキシ基、から選択される１つ以上の置換基で置換されていてもよいＣ$_{1-5}$アルキルオキシ基；フッ素原子、水酸基、シアノ基、メチル基、オキソ基、及びメトキシ基、から選択される１つ以上の置換基で置換されていてもよいＣ$_{1-3}$アルキルオキシＣ$_{1-3}$アルキル基；水酸基で置換されていてもよいＣ$_{1-3}$アルキル基、水酸基、及びシアノ基、から選択される１つ以上の置換基で置換されていてもよいＣ$_{3-6}$シクロアルキルオキシ基；酸素原子及び硫黄原子から選択される１～３個のヘテロ原子を含み、硫黄原子を含む場合には硫黄原子に１つ以上のオキソ基が結合していてもよい４～６員の単環式非芳香族性複素環オキシ基；Ｃ$_{1-3}$アルキルチオ基；水酸基及びフッ素原子から選択される１つ以上の置換基で置換されていてもよいＣ$_{1-3}$アルキルスルホニル基；水酸基及びフッ素原子から選択される１つ以上の置換基で置換されていてもよいＣ$_{1-3}$アルキルスルフィニル基；スルファモイル基；Ｃ$_{1-3}$アルキルカルボニル基；アミノカルボニル基；モノＣ$_{1-3}$アルキルアミノカルボニル基；水酸基で置換されていてもよいジＣ$_{1-3}$アルキルアミノカルボニル基；Ｃ$_{3-6}$シクロアルキルアミノ基；Ｃ$_{7-9}$単環式アラルキルアミノカルボニル基；又はＣ$_{1-3}$アルキルオキシカルボニル基であり、

Ｒ^{4}が示す基が、上記のうち、いずれの位置で置換されていてもよい、オキサゾリル基、チアゾリル基、メチルチアゾリル基、イソチアゾリル基、ピラゾリル基、メチルピラゾリル基、トリアゾリル基、１，２，４－チアジアゾリル、メチル－１，２，４－チアジアゾリル、ピリジル基、クロロピリジル基、フルオロピリジル基、ピリミジニル基、又はフラニル基である、

化合物。

【００７３】

［化合物（１ｆ）］

一般式（１）中、

Ｒ^{1}が示す基が、上記のうち、水素原子、フッ素原子、塩素原子、カルボキシ基、シアノ基、メチル基、エチル基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、モルホリノメチル基、（ジメチルアミノ）メチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－

イル基、１－ヒドロキシエチル基、１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－２－メチルプロピル基、１－メトキシエチル基、２－メトキシプロパン－２－イル基、１－アセトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル基、１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル基、１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（カルボキシメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（２－アミノ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（メチルスルホニル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（スルファモイルメトキシ）エチル基、１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１，１，４，４，４－ヘキサフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル基、１－（（１，３－ジヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－３－オキソブタン－２－イル基、１，１，１，４，４，４－ヘキサフルオロ－３－オキソブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－３，４－ジヒドロキシブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－４－ヒドロキシ－３－オキソブタン－２－イル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２－ジフルオロエチル基、１－ヒドロキシ－３－（メチルスルホニル）プロピル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－３－（メチルスルホニル）プロピル基、３－（エチルスルホニル）－１－ヒドロキシプロピル基、３－（エチルスルホニル）－２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－（イソプロピルスルホニル）プロピル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－３－（イソプロピルスルホニル）プロピル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－モルホリノ－２－オキソエトキシ）エチル基、１－ヒドロキシ－２－モルホリノエチル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－モルホリノエチル基、１－カルボキシ－２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、１－カルボキシ－２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－１－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシ－１－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）エチル基、１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブタン－２－イル基、３－シアノ－１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，３－ジヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－メトキシプロピル基、４，４，４－トリフルオロ－１，３－ジヒドロキシブチル基、１，３－ジヒドロキシブチル基、１，３－ジヒドロキシ－３－メチルブチル基、シクロプロピル（ヒドロキシ）メチル基、カルボキシ（ヒドロキシ）メチル基、ヒドロキシ（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メチル基、ヒドロキシ（３－ヒドロキシシクロブチル）メチル基、３－アミノ－１－ヒドロキシ－３－オキソプロピル基、１－ヒドロキシ－２－（メチルスルホンアミド）エチル基、２－シアノエチル基、１，２－ジヒドロキシエチル基、３，３，３－トリフルオロ－１，２－ジヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－１－ヒ

ドロキシ－２－オキソプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－１－ヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－２－オキソプロピル基、１－ヒドロキシ－３－オキソブチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、フェニル基、ベンジル基、チアゾール－２－イル基、１Ｈ－ピラゾール－１－イル基、５－メチルチアゾール－２－イル基、５－メトキシカルボニルチアゾール－２－イル基、５－ヒドロキシメチルチアゾール－２－イル基、５－（１－ヒドロキシエチル）チアゾール－２－イル基、５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－イル基、５－（Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノメチル）チアゾール－２－イル基、５－メチルチアゾール－４－イル基、オキサゾール－２－イル基、オキサゾール－４－イル基、５－メチルオキサゾール－４－イル基、１Ｈ－イミダゾール－１－イル基、２，５－ジメチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル基、１Ｈ－イミダゾール－４－イル基、１－メチル－１Ｈ－イミダゾール－２－イル基、１－メチル－１Ｈ－イミダゾール－４－イル基、ピリジン－２－イル基、ピリジン－３－イル基、ピリジン－４－イル基、３，５－ジメチルピリジン－４－イル基、６－ヒドロキシピリジン－２－イル基、５－ヒドロキシピリジン－２－イル基、４－ヒドロキシピリジン－２－イル基、３－ヒドロキシピリジン－２－イル基、６－メトキシピリジン－２－イル基、５－メトキシピリジン－２－イル基、４－メトキシピリジン－２－イル基、３－メトキシピリジン－２－イル基、ピリミジン－２－イル基、ピリミジン－４－イル基、１，３，５－トリアジン－２－イル基、テトラヒドロフラン－２－イル基、テトラヒドロフラン－３－イル基、テトラヒドロピラン－２－イル基、テトラヒドロピラン－３－イル基、テトラヒドロピラン－４－イル基、オキセタニル基、ピロリジン－１－イル基、ピペリジン－１－イル基、ピペラジン－１－イル基、モルホリン－４－イル基、アゼチジン－１－イル基、４－ヒドロキシピペリジン－１－イル基、３－ヒドロキシピロリジン－１－イル基、３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、メチルエチルアミノ基、シクロブチルアミノ基、シクロペンチルアミノ基、シクロヘキシルアミノ基、アセトアミド基、Ｎ－メチルアセトアミド基、プロピオニルアミノ基、ブチリルアミノ基、イソブチリルアミノ基、バレリルアミノ基、イソバレリルアミノ基、メトキシ基、エトキシ基、ｎ－プロポキシ基、イソプロポキシ基、ｎ－ブトキシ基、イソブトキシ基、トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、２，２，２－トリフルオロエトキシ基、シアノメトキシ基、カルボキシメトキシ基、２－ヒドロキシエトキシ基、２－メトキシエトキシ基、２－ヒドロキシプロポキシ基、２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、２，２－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、２－（トリフルオロメトキシ）エトキシ基、（１，３－ジヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ基、（１－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメトキシ）プロパン－２－イル）オキシ基、２－オキソプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－オキソプロポキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－オキソブタン－２－イル）オキシ基、３，３，３－トリフルオロ－２－オキソプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル）オキシ基、オキセタン－３－イルメトキシ基、３－ヒドロキシ－２－（ヒドロキシメチル）プロポキシ基、アリルオキシ基、シクロブトキシ基、（メチルスルホニル）メトキシ基、（エチルスルホニル）メトキシ基、（イソプロピルスルホニル）メトキシ基、（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ基、２－アミノ－２－オキソエトキシ基、シアノジフルオロメトキシ基、カルボキシジフルオロメトキシ基、ジフルオロ（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ基、ジフルオロ（メチルスルホニル）メトキシ基、２－カルボキシエトキシ基、２－シアノエトキシ基、２－（メチルスルホニル）エトキシ基、２－モルホリノエトキシ基、３－ヒドロキシシクロブトキシ基、３－シアノシクロブトキシ基、３－カルボキシシクロブトキシ基、３－（メチルスルホニル）シクロブトキシ基

、３－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）シクロブトキシ基、（４－ヒドロキシシクロヘキシル）オキシ基、２－ヒドロキシ－３－メトキシプロポキシ基、フェニルオキシ基、ベンジルオキシ基、チアゾール－５－イルオキシ基、チアゾール－４－イルオキシ基、ピリジン－４－イルオキシ基、ピリジン－３－イルオキシ基、メチルチオ基、メチルスルホニル基、メチルスルフィニル基、メチルスルファモイル基、ジメチルスルファモイル基、スルファモイル基、アセチル基、２，２－ジフルオロアセチル基、１－（メトキシイミノ）エチル基、カルバモイル基、ジメチルカルバモイル基、モルホリン－４－カルボニル基、ピペリジン－１－カルボニル基、アゼチジン－１－カルボニル基、ベンジルカルバモイル基、メチルカルバモイル基、３－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）アゼチジン－１－カルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル）オキシ基、ジフルオロメトキシ基、３－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）シクロブトキシ基、（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（３－ヒドロキシ－２，３－ジメチルブタン－２－イル）オキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－メトキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基、１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブトキシ基、（１，１－ジオキシドテトラヒドロ－２Ｈ－チオピラン－４－イル）オキシ）基、オキセタン－３－イルオキシ基、１，１－ジフルオロ－２，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、（トリフルオロメチル）スルホニル基、（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、ピリジン－２－イルオキシ基、ピリミジン－２－イルオキシ基、ピラジン－２－イルオキシ基、（６－メチル－４－（トリフルオロメチル）ピリダジン－３－イル）オキシ基、（５－（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、（５－（ヒドロキシメチル）－３－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、（５－（トリフルオロメトキシ）ピリジン－２－イル）オキシ基、（２－ヒドロキシエチル）チオ基、（２－ヒドロキシエチル）スルフィニル基、（２－ヒドロキシエチル）スルホニル基、（１，１－ジフルオロアリル）オキシ基、（５－（メチルスルホニル）ピリジン－２－イル）オキシ基、（２－メトキシエチル）カルバモイル基、（２－ヒドロキシエチル）カルバモイル基、（２－ヒドロキシエチル）（メチル）カルバモイル基、シクロプロピルカルバモイル基、エチルカルバモイル基、ピロリジン－１－カルボニル基、ヒドロキシカルバモイル基、１，１－ジフルオロ－２，３－ジヒドロキシプロポキシ基、３－（（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、１，１－ジフルオロ－２，２－ジヒドロキシプロポキシ基、Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）スルファモイル基、Ｎ－（２－メトキシエチル）スルファモイル基、Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルスルファモイル基、ピロリジン－１－イルスルホニル基、モルホリノスルホニル基、１，１－ジフルオロ－２－メトキシエトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－メトキシ－２－メチルプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシブトキシ基、１，１－ジオキシドチオモルホリノ基、１，１－ジフルオロプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－３－メチルブトキシ基、ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イルジフルオロメトキシ基、（１，１－ジフルオロ－３－（ピリジン－３－イル）アリル）オキシ基、１，１－ジフルオロ－２－（（２－ヒドロキシエチル）（メチル）アミノ）－２－オキソエトキシ基、２－（ジメチルアミノ）－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－モルホリノ－２－オキソエトキシ基、２－アミノ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－（（２－ヒドロキシエチル）アミノ）－２－オキソエトキシ基、又は１，１－ジフルオロ－２－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）－２－オキソエトキシ基であり、

R^2が示す基が、上記のうち、水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、カルボキシ基、シアノ基、メチル基、エチル基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、２－ヒドロキシプロパン－２－

イル基、モルホリノメチル基、（ジメチルアミノ）メチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル基、１－ヒドロキシエチル基、１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－２－メチルプロピル基、１－メトキシエチル基、２－メトキシプロパン－２－イル基、１－アセトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル基、１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル基、１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（カルボキシメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（２－アミノ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（メチルスルホニル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（スルファモイルメトキシ）エチル基、１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１，１，４，４，４－ヘキサフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル基、１－（（１，３－ジヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－３－オキソブタン－２－イル基、１，１，１，４，４，４－ヘキサフルオロ－３－オキソブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－３，４－ジヒドロキシブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－４－ヒドロキシ－３－オキソブタン－２－イル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２－ジフルオロエチル基、１－ヒドロキシ－３－（メチルスルホニル）プロピル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－３－（メチルスルホニル）プロピル基、３－（エチルスルホニル）－１－ヒドロキシプロピル基、３－（エチルスルホニル）－２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－（イソプロピルスルホニル）プロピル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－３－（イソプロピルスルホニル）プロピル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－モルホリノ－２－オキソエトキシ）エチル基、１－ヒドロキシ－２－モルホリノエチル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－２－モルホリノエチル基、１－カルボキシ－２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、１－カルボキシ－２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－１－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシ－１－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）エチル基、１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブタン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブタン－２－イル基、３－シアノ－１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，３－ジヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－メトキシプロピル基、４，４，４－トリフルオロ－１，３－ジヒドロキシブチル基、１，３－ジヒドロキシブチル基、１，３－ジヒドロキシ－３－メチルブチル基、シクロプ

ロピル（ヒドロキシ）メチル基、カルボキシ（ヒドロキシ）メチル基、ヒドロキシ（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メチル基、ヒドロキシ（３－ヒドロキシシクロブチル）メチル基、３－アミノ－１－ヒドロキシ－３－オキソプロピル基、１－ヒドロキシ－２－（メチルスルホンアミド）エチル基、２－シアノエチル基、１，２－ジヒドロキシエチル基、３，３，３－トリフルオロ－１，２－ジヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシシクロプロピル基、１－メトキシシクロプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－１－ヒドロキシ－２－オキソプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－１－ヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－２－オキソプロピル基、１－ヒドロキシ－３－オキソブチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、フェニル基、ベンジル基、チアゾール－２－イル基、１Ｈ－ピラゾール－１－イル基、５－メチルチアゾール－２－イル基、５－メトキシカルボニルチアゾール－２－イル基、５－ヒドロキシメチルチアゾール－２－イル基、５－（１－ヒドロキシエチル）チアゾール－２－イル基、５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）チアゾール－２－イル基、５－（Ｎ，Ｎ－ジメチルアミノメチル）チアゾール－２－イル基、５－メチルチアゾール－４－イル基、オキサゾール－２－イル基、オキサゾール－４－イル基、５－メチルオキサゾール－４－イル基、１Ｈ－イミダゾール－１－イル基、２，５－ジメチル－１Ｈ－イミダゾール－１－イル基、１Ｈ－イミダゾール－４－イル基、１－メチル－１Ｈ－イミダゾール－２－イル基、１－メチル－１Ｈ－イミダゾール－４－イル基、ピリジン－２－イル基、ピリジン－３－イル基、ピリジン－４－イル基、３，５－ジメチルピリジン－４－イル基、６－ヒドロキシピリジン－２－イル基、５－ヒドロキシピリジン－２－イル基、４－ヒドロキシピリジン－２－イル基、３－ヒドロキシピリジン－２－イル基、６－メトキシピリジン－２－イル基、５－メトキシピリジン－２－イル基、４－メトキシピリジン－２－イル基、３－メトキシピリジン－２－イル基、ピリミジン－２－イル基、ピリミジン－４－イル基、１，３，５－トリアジン－２－イル基、テトラヒドロフラン－２－イル基、テトラヒドロフラン－３－イル基、テトラヒドロピラン－２－イル基、テトラヒドロピラン－３－イル基、テトラヒドロピラン－４－イル基、オキセタニル基、ピロリジン－１－イル基、ピペリジン－１－イル基、ピペラジン－１－イル基、モルホリン－４－イル基、アゼチジン－１－イル基、４－ヒドロキシピペリジン－１－イル基、３－ヒドロキシピロリジン－１－イル基、３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、メチルエチルアミノ基、シクロブチルアミノ基、シクロペンチルアミノ基、シクロヘキシルアミノ基、アセトアミド基、Ｎ－メチルアセトアミド基、プロピオニルアミノ基、ブチリルアミノ基、イソブチリルアミノ基、バレリルアミノ基、イソバレリルアミノ基、メトキシ基、エトキシ基、ｎ－プロポキシ基、イソプロポキシ基、ｎ－ブトキシ基、イソブトキシ基、トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、２，２，２－トリフルオロエトキシ基、シアノメトキシ基、カルボキシメトキシ基、２－ヒドロキシエトキシ基、２－メトキシエトキシ基、２－ヒドロキシプロポキシ基、２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、２，２－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、２－（トリフルオロメトキシ）エトキシ基、（１，３－ジヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ基、（１－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメトキシ）プロパン－２－イル）オキシ基、２－オキソプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－オキソプロポキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－オキソブタン－２－イル）オキシ基、３，３，３－トリフルオロ－２－オキソプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル）オキシ基、オキセタン－３－イルメトキシ基、３－ヒドロキシ－２－（ヒドロキシメチル）プロポキシ基、アリルオキシ基、シクロブトキシ基、（メチルスルホニル）メトキシ基、（エチルスルホニル）メトキシ基、（イソプロピルスルホニル）メトキシ基、（２

Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ基、２－アミノ－２－オキソエトキシ基、シアノジフルオロメトキシ基、カルボキシジフルオロメトキシ基、ジフルオロ（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ基、ジフルオロ（メチルスルホニル）メトキシ基、２－カルボキシエトキシ基、２－シアノエトキシ基、２－（メチルスルホニル）エトキシ基、２－モルホリノエトキシ基、３－ヒドロキシシクロブトキシ基、３－シアノシクロブトキシ基、３－カルボキシシクロブトキシ基、３－（メチルスルホニル）シクロブトキシ基、３－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）シクロブトキシ基、（４－ヒドロキシシクロヘキシル）オキシ基、２－ヒドロキシ－３－メトキシプロポキシ基、フェニルオキシ基、ベンジルオキシ基、チアゾール－５－イルオキシ基、チアゾール－４－イルオキシ基、ピリジン－４－イルオキシ基、ピリジン－３－イルオキシ基、メチルチオ基、メチルスルホニル基、メチルスルフィニル基、メチルスルファモイル基、ジメチルスルファモイル基、スルファモイル基、アセチル基、２，２－ジフルオロアセチル基、１－（メトキシイミノ）エチル基、カルバモイル基、ジメチルカルバモイル基、モルホリン－４－カルボニル基、ピペリジン－１－カルボニル基、アゼチジン－１－カルボニル基、ベンジルカルバモイル基、メチルカルバモイル基、３－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）アゼチジン－１－カルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、又は（５－（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基であり、

R^4が示す基が、上記のうち、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、クロロチアゾリル基、シアノチアゾリル基、メチルチアゾリル基、ヒドロキシメチルチアゾリル基、カルバモイルチアゾリル基、ニトロチアゾリル基、フルオロチアゾリル基、ジフルオロチアゾリル基、重水素化されたチアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、メチルイミダゾリル基、トリアゾリル基、ピリジル基、クロロピリジル基、フルオロピリジル基、シアノピリジル基、メチルピリジル基、ピリミジニル基、テトラゾリル基、又はフラニル基である、

化合物。

【００７４】

［化合物（１ｇ）］

一般式（１）中、

R^1が示す基が、上記のうち、水素原子、塩素原子、シアノ基、カルボキシ基、メチル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル基、１－ヒドロキシエチル基、１－メトキシエチル基、２－メトキシプロパン－２－イル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル基、１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル基、１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（カル

ボキシメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（２－アミノ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（メチルスルホニル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（スルファモイルメトキシ）エチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２－ジフルオロエチル基、１－ヒドロキシ－３－（メチルスルホニル）プロピル基、３－（エチルスルホニル）－１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－（イソプロピルスルホニル）プロピル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－モルホリノ－２－オキソエトキシ）エチル基、１－カルボキシ－２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－１－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）エチル基、フェニル基、チアゾール－２－イル基、アセトアミド基、メトキシ基、トリフルオロメトキシ基、シアノメトキシ基、カルボキシメトキシ基、２－ヒドロキシエトキシ基、２－メトキシエトキシ基、２－ヒドロキシプロポキシ基、２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、２，２－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、２－（トリフルオロメトキシ）エトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル）オキシ基、シクロブトキシ基、（メチルスルホニル）メトキシ基、（エチルスルホニル）メトキシ基、（イソプロピルスルホニル）メトキシ基、（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ基、２－アミノ－２－オキソエトキシ基、カルボキシジフルオロメトキシ基、２－カルボキシエトキシ基、２－シアノエトキシ基、２－（メチルスルホニル）エトキシ基、２－モルホリノエトキシ基、３－ヒドロキシシクロブトキシ基、３－シアノシクロブトキシ基、３－カルボキシシクロブトキシ基、３－（メチルスルホニル）シクロブトキシ基、３－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）シクロブトキシ基、（４－ヒドロキシシクロヘキシル）オキシ基、２－ヒドロキシ－３－メトキシプロポキシ基、ベンジルオキシ基、アセチル基、カルバモイル基、ジメチルカルバモイル基、モルホリン－４－カルボニル基、ピペリジン－１－カルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル）オキシ基、ジフルオロメトキシ基、３－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）シクロブトキシ基、（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（３－ヒドロキシ－２，３－ジメチルブタン－２－イル）オキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－メトキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基、１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブトキシ基、（１，１－ジオキシドテトラヒドロ－２Ｈ－チオピラン－４－イル）オキシ）基、オキセタン－３－イルオキシ基、１，１－ジフルオロ－２，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、（トリフルオロメチル）スルホニル基、（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、ピリジン－２－イルオキシ基、ピリミジン－２－イルオキシ基、ピラジン－２－イルオキシ基、（６－メチル－４－（トリフルオロメチル）ピリダジン－３－イル）オキシ基、（５－（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、（５－（ヒドロキシメチル）－３－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、（５－（トリフルオロメトキシ）ピリジン－２－イル）オキシ基、メチルスルホニル基、シクロプロピル基、メチルチオ基、メチルスルフィニル基、（２－ヒドロキシエチル）チオ基、（２－ヒドロキシエチル）スルフィニル基、（２－ヒドロキシエチル）スルホニル基、（１，１－ジフルオロアリル）オキシ基、（５－（メチルスルホニル）ピリジン－２－イル）オキシ基、（２－メトキシエチル）カルバモイル基、（２－ヒドロキシエチル）カルバモイル基、（２－ヒドロキシエチル）（メチル）カルバモイル基、シクロプロピルカルバモイル基

、エチルカルバモイル基、ピロリジン－１－カルボニル基、ベンジルカルバモイル基、ヒドロキシカルバモイル基、１，１－ジフルオロ－２，３－ジヒドロキシプロポキシ基、３－（（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、１，１－ジフルオロ－２，２－ジヒドロキシプロポキシ基、Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）スルファモイル基、Ｎ－（２－メトキシエチル）スルファモイル基、Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルスルファモイル基、ピロリジン－１－イルスルホニル基、モルホリノスルホニル基、１，１－ジフルオロ－２－メトキシエトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－メトキシ－２－メチルプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシブトキシ基、１，１－ジオキシドチオモルホリノ基、１，１－ジフルオロプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－３－メチルブトキシ基、ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イルジフルオロメトキシ基、（１，１－ジフルオロ－３－（ピリジン－３－イル）アリル）オキシ基、１，１－ジフルオロ－２－（（２－ヒドロキシエチル）（メチル）アミノ）－２－オキソエトキシ基、２－（ジメチルアミノ）－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－モルホリノ－２－オキソエトキシ基、２－アミノ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－（（２－ヒドロキシエチル）アミノ）－２－オキソエトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）－２－オキソエトキシ基、又はシクロブチル基であり、

R^2が示す基が、上記のうち、水素原子、塩素原子、臭素原子、カルボキシ基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、モルホリノメチル基、（ジメチルアミノ）メチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル基、１－ヒドロキシエチル基、１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－２－メチルプロピル基、１－メトキシエチル基、２－メトキシプロパン－２－イル基、１－アセトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル基、１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル基、１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（カルボキシメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（２－アミノ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（メチルスルホニル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（スルファモイルメトキシ）エチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２－ジフルオロエチル基、１－ヒドロキシ－３－（メチルスルホニル）プロピル基、３－（エチルスルホニル）－１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－（イソプロピルスルホニル）プロピル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－モルホリノ－２－オキソエトキシ）エチル基、１－カルボキシ－２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－１－（２Ｈ－

テトラゾール－５－イル）エチル基、１，３－ジヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－メトキシプロピル基、４，４，４－トリフルオロ－１，３－ジヒドロキシブチル基、１，３－ジヒドロキシブチル基、１，３－ジヒドロキシ－３－メチルブチル基、カルボキシ（ヒドロキシ）メチル基、ヒドロキシ（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メチル基、ヒドロキシ（３－ヒドロキシシクロブチル）メチル基、１－ヒドロキシ－２－モルホリノエチル基、３－アミノ－１－ヒドロキシ－３－オキソプロピル基、１－ヒドロキシ－２－（メチルスルホンアミド）エチル基、２－シアノエチル基、１，２－ジヒドロキシエチル基、３，３，３－トリフルオロ－１，２－ジヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシシクロプロピル基、１－メトキシシクロプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－１－ヒドロキシ－２－オキソプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－１－ヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－２－オキソプロピル基、１－ヒドロキシ－３－オキソブチル基、アセトアミド基、Ｎ－メチルアセトアミド基、メトキシ基、イソプロポキシ基、トリフルオロメトキシ基、２，２，２－トリフルオロエトキシ基、シアノメトキシ基、カルボキシメトキシ基、２－ヒドロキシエトキシ基、２－メトキシエトキシ基、２－ヒドロキシプロポキシ基、（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、２，２－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、２－（トリフルオロメトキシ）エトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル）オキシ基、オキセタン－３－イルメトキシ基、３－ヒドロキシ－２－（ヒドロキシメチル）プロポキシ基、アリルオキシ基、シクロブトキシ基、（メチルスルホニル）メトキシ基、（エチルスルホニル）メトキシ基、（イソプロピルスルホニル）メトキシ基、（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ基、２－アミノ－２－オキソエトキシ基、カルボキシジフルオロメトキシ基、２－カルボキシエトキシ基、２－シアノエトキシ基、２－（メチルスルホニル）エトキシ基、２－モルホリノエトキシ基、３－ヒドロキシシクロブトキシ基、３－シアノシクロブトキシ基、３－カルボキシシクロブトキシ基、３－（メチルスルホニル）シクロブトキシ基、３－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）シクロブトキシ基、（４－ヒドロキシシクロヘキシル）オキシ基、２－ヒドロキシ－３－メトキシプロポキシ基、ベンジルオキシ基、メチルチオ基、メチルスルホニル基、メチルスルフィニル基、メチルスルファモイル基、ジメチルスルファモイル基、スルファモイル基、アセチル基、１－（メトキシイミノ）エチル基、カルバモイル基、ジメチルカルバモイル基、モルホリン－４－カルボニル基、ピペリジン－１－カルボニル基、アゼチジン－１－カルボニル基、ベンジルカルバモイル基、メチルカルバモイル基、３－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）アゼチジン－１－カルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、又は（５－（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基であり、

Ｒ^{4}が示す基が、上記のうち、チアゾール－２－イル基、チアゾール－４－イル基、ピリジン－２－イル基、オキサゾール－２－イル基、１Ｈ－ピラゾール－１－イル基、４－メチルチアゾール－２－イル基、５－フルオロピリジン－２－イル基、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル基、１，２，４－チアジアゾール－５－イル基、１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル基、ピリミジン－２－イル基、イソチアゾール－３－イル基、３－メチル－１，２，４－チアジアゾール－５－イル基、又は５－クロロピリジン－２－イル基である、

化合物。

【００７５】

［化合物（１ｈ）］

一般式（１）中、

Ｒ^{1}が示す基が、上記のうち、水素原子、塩素原子、シアノ基、カルボキシ基、メチル

基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル基、１－ヒドロキシエチル基、１－メトキシエチル基、２－メトキシプロパン－２－イル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル基、１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル基、１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（カルボキシメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（２－アミノ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（メチルスルホニル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（スルファモイルメトキシ）エチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２－ジフルオロエチル基、１－ヒドロキシ－３－（メチルスルホニル）プロピル基、３－（エチルスルホニル）－１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－（イソプロピルスルホニル）プロピル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－モルホリノ－２－オキソエトキシ）エチル基、１－カルボキシ－２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－１－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）エチル基、フェニル基、チアゾール－２－イル基、アセトアミド基、メトキシ基、トリフルオロメトキシ基、シアノメトキシ基、カルボキシメトキシ基、２－ヒドロキシエトキシ基、２－メトキシエトキシ基、２－ヒドロキシプロポキシ基、２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、２，２－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、２－（トリフルオロメトキシ）エトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル）オキシ基、シクロブトキシ基、（メチルスルホニル）メトキシ基、（エチルスルホニル）メトキシ基、（イソプロピルスルホニル）メトキシ基、（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ基、２－アミノ－２－オキソエトキシ基、カルボキシジフルオロメトキシ基、２－カルボキシエトキシ基、２－シアノエトキシ基、２－（メチルスルホニル）エトキシ基、２－モルホリノエトキシ基、３－ヒドロキシシクロブトキシ基、３－シアノシクロブトキシ基、３－カルボキシシクロブトキシ基、３－（メチルスルホニル）シクロブトキシ基、３－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）シクロブトキシ基、（４－ヒドロキシシクロヘキシル）オキシ基、２－ヒドロキシ－３－メトキシプロポキシ基、ベンジルオキシ基、アセチル基、カルバモイル基、ジメチルカルバモイル基、モルホリン－４－カルボニル基、ピペリジン－１－カルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ

）－２，２，２－トリフルオロエチル基、テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル）オキシ基、ジフルオロメトキシ基、３－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）シクロブトキシ基、（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（３－ヒドロキシ－２，３－ジメチルブタン－２－イル）オキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－メトキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基、１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブトキシ基、（１，１－ジオキシドテトラヒドロ－２Ｈ－チオピラン－４－イル）オキシ）基、オキセタン－３－イルオキシ基、１，１－ジフルオロ－２，３－ジヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、（トリフルオロメチル）スルホニル基、（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、ピリジン－２－イルオキシ基、ピリミジン－２－イルオキシ基、ピラジン－２－イルオキシ基、（６－メチル－４－（トリフルオロメチル）ピリダジン－３－イル）オキシ基、（５－（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、（５－（ヒドロキシメチル）－３－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、（５－（トリフルオロメトキシ）ピリジン－２－イル）オキシ基、メチルスルホニル基、シクロプロピル基、メチルチオ基、メチルスルフィニル基、（２－ヒドロキシエチル）チオ基、（２－ヒドロキシエチル）スルフィニル基、（２－ヒドロキシエチル）スルホニル基、（１，１－ジフルオロアリル）オキシ基、（５－（メチルスルホニル）ピリジン－２－イル）オキシ基、（２－メトキシエチル）カルバモイル基、（２－ヒドロキシエチル）カルバモイル基、（２－ヒドロキシエチル）（メチル）カルバモイル基、シクロプロピルカルバモイル基、エチルカルバモイル基、ピロリジン－１－カルボニル基、ベンジルカルバモイル基、ヒドロキシカルバモイル基、１，１－ジフルオロ－２，３－ジヒドロキシプロポキシ基、３－（（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、１，１－ジフルオロ－２，２－ジヒドロキシプロポキシ基、Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）スルファモイル基、Ｎ－（２－メトキシエチル）スルファモイル基、Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルスルファモイル基、ピロリジン－１－イルスルホニル基、モルホリノスルホニル基、１，１－ジフルオロ－２－メトキシエトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－メトキシ－２－メチルプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシブトキシ基、１，１－ジオキシドチオモルホリノ基、１，１－ジフルオロプロポキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－３－メチルブトキシ基、ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イルジフルオロメトキシ基、（１，１－ジフルオロ－３－（ピリジン－３－イル）アリル）オキシ基、１，１－ジフルオロ－２－（（２－ヒドロキシエチル）（メチル）アミノ）－２－オキソエトキシ基、２－（ジメチルアミノ）－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－モルホリノ－２－オキソエトキシ基、２－アミノ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－（（２－ヒドロキシエチル）アミノ）－２－オキソエトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）－２－オキソエトキシ基、又はシクロブチル基であり、

R^2が示す基が、上記のうち水素原子であり、

R^4が示す基が、上記のうち、チアゾール－２－イル基、チアゾール－４－イル基、ピリジン－２－イル基、オキサゾール－２－イル基、１Ｈ－ピラゾール－１－イル基、４－メチルチアゾール－２－イル基、５－フルオロピリジン－２－イル基、２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル基、１，２，４－チアジアゾール－５－イル基、１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル基、ピリミジン－２－イル基、イソチアゾール－３－イル基、３－メチル－１，２，４－チアジアゾール－５－イル基、又は５－クロロピリジン－２－イル基である、

化合物。

【００７６】

［化合物（１ｉ）］

一般式（１）中、

R^1が示す基が、上記のうち水素原子であり、

R^2が示す基が、上記のうち、塩素原子、カルボキシ基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシメチル基、メトキシメチル基、２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、モルホリノメチル基、（ジメチルアミノ）メチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル基、１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル基、１－ヒドロキシエチル基、１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－２－メチルプロピル基、１－メトキシエチル基、２－メトキシプロパン－２－イル基、１－アセトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル基、１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル基、１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ）エチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（カルボキシメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（２－アミノ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（（メチルスルホニル）メトキシ）エチル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（スルファモイルメトキシ）エチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル基、１－（（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２－ジフルオロエチル基、１－ヒドロキシ－３－（メチルスルホニル）プロピル基、３－（エチルスルホニル）－１－ヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－（イソプロピルスルホニル）プロピル基、２，２，２－トリフルオロ－１－（２－モルホリノ－２－オキソエトキシ）エチル基、１－カルボキシ－２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル基、２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシ－１－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）エチル基、１，３－ジヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシ－３－メトキシプロピル基、４，４，４－トリフルオロ－１，３－ジヒドロキシブチル基、１，３－ジヒドロキシブチル基、１，３－ジヒドロキシ－３－メチルブチル基、カルボキシ（ヒドロキシ）メチル基、ヒドロキシ（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メチル基、ヒドロキシ（３－ヒドロキシシクロブチル）メチル基、１－ヒドロキシ－２－モルホリノエチル基、３－アミノ－１－ヒドロキシ－３－オキソプロピル基、１－ヒドロキシ－２－（メチルスルホンアミド）エチル基、２－シアノエチル基、１，２－ジヒドロキシエチル基、３，３，３－トリフルオロ－１，２－ジヒドロキシプロピル基、１－ヒドロキシシクロプロピル基、１－メトキシシクロプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－１－ヒドロキシ－２－オキソプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－１－ヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロピル基、３，３，３－トリフルオロ－２－オキソプロピル基、１－ヒドロキシ－３－オキソブチル基、アセトアミド基、Ｎ－メチルアセトアミド基、メトキシ基、イソプロポキシ基、トリフルオロメトキシ基、２，２，２－トリフルオロエトキシ基、シアノメトキシ基、カルボキシメトキシ基、２－ヒドロキシエトキシ基、２－メトキシエトキシ基、２－ヒドロキシプロポキシ基、（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ基、ジフルオロ（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエ

トキシ基、３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、２，２－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ基、２－（トリフルオロメトキシ）エトキシ基、１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ基、（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシブタン－２－イル）オキシ基、オキセタン－３－イルメトキシ基、３－ヒドロキシ－２－（ヒドロキシメチル）プロポキシ基、アリルオキシ基、シクロブトキシ基、（メチルスルホニル）メトキシ基、（エチルスルホニル）メトキシ基、（イソプロピルスルホニル）メトキシ基、（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ基、２－アミノ－２－オキソエトキシ基、カルボキシジフルオロメトキシ基、２－カルボキシエトキシ基、２－シアノエトキシ基、２－（メチルスルホニル）エトキシ基、２－モルホリノエトキシ基、３－ヒドロキシシクロブトキシ基、３－シアノシクロブトキシ基、３－カルボキシシクロブトキシ基、３－（メチルスルホニル）シクロブトキシ基、３－（２Ｈ－テトラゾール－５－イル）シクロブトキシ基、（４－ヒドロキシシクロヘキシル）オキシ基、２－ヒドロキシ－３－メトキシプロポキシ基、ベンジルオキシ基、メチルチオ基、メチルスルホニル基、メチルスルフィニル基、メチルスルファモイル基、ジメチルスルファモイル基、スルファモイル基、アセチル基、１－（メトキシイミノ）エチル基、カルバモイル基、ジメチルカルバモイル基、モルホリン－４－カルボニル基、ピペリジン－１－カルボニル基、アゼチジン－１－カルボニル基、ベンジルカルバモイル基、メチルカルバモイル基、３－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）アゼチジン－１－カルボニル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基、又は（５－（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ基であり、

R^4が示す基が、上記のうち、チアゾール－２－イル基又は１Ｈ－ピラゾール－１－イル基である、

化合物。

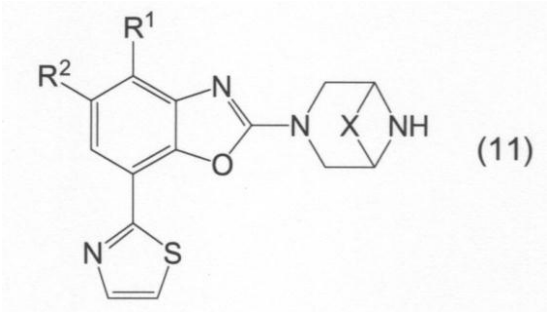
【００７７】

［化合物（１ｊ）］

下記一般式（１１）で表される化合物。

【００７８】

【化４】



(11)

【００７９】

［式（１１）中、

R^1が示す基が、上記のうち、置換されていてもよいC_{1-6}アルキル基、又は置換されていてもよいC_{1-6}アルキルオキシ基であり、

R^2が示す基が、上記のうち、水素原子、ハロゲン原子、置換されていてもよいC_{1-6}アルキル基、又は置換されていてもよいC_{1-6}アルキルカルボニル基であり、

Ｘが示す基が、上記のうち、次式：－CH_2－、－CH_2－CH_2－、－CH_2－CH_2－CH_2－、又は－CH_2－Ｏ－CH_2－で示される基である。］

前記一般式（１１）において、各基が置換されている場合の置換基としては、ハロゲン原子（より好ましくは、フッ素原子又は塩素原子）、水酸基、及びC_{1-6}アルキルオキシ基（より好ましくはメトキシ基）が好ましく、これらのうちの１種を単独であっても２種以上の組み合わせであってもよい。

【００８０】

本発明に係る化合物又はその薬理的に許容される塩のさらなる具体的態様として、例え

ば、前記一般式（１）で表される化合物が下記の化合物である態様が挙げられる。
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
７－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（フラン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（オキサゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
７－（５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
７－（５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン、
７－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－

（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
７－（５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
Ｎ－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）アセトアミド、
Ｎ－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）アセトアミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メチルスル

フィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
Ｎ－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド、
Ｎ－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド、
Ｎ－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－オール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－イソプロポキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（オキセタン

－３－イルメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）メチル）プロパン－１，３－ジオール、
５－（アリルオキシ）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）アセトニトリル、
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）酢酸、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－オール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－シクロブトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）アセトニトリル、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３－メトキシプロパン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４，７－ジ（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－７－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－７－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（１Ｈ

－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（モルホリノ）メタノン、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（ピペリジン－１－イル）メタノン、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（アゼチジン－１－イル）メタノン、
Ｎ－ベンジル－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド、
Ｎ－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－Ｎ－メチルアセトアミド、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（モルホリノメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルメタンアミン、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、

１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール、
（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール、
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート、
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート、
エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（モルホリノ）メタノン、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（ピペリジン－１－イル）メタノン、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（Ｒ）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（Ｓ）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チ

アゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
（Ｒ）－２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
（Ｓ）－２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チア

ゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエチルアセテート、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（Ｒ）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（Ｓ）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）エタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル、
２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）プロパン－２－オール、
１－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール、

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メトキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）メタノール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル

）エタン－１－オン、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキ

シプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（アゼチジン－１－イル）メタノン、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（３－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）アゼチジン－１－イル）メタノン、
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）メタノール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２－メチルプロパン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、

（Ｓ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
（Ｅ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム、
（Ｚ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム、
（Ｅ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム、
（Ｚ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエト

キシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）エタン－１－オール、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）エタン－１－オール、
２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
４－（１－（（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
４－（１－（（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）メチル）シクロプロパン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
（Ｒ）－２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
（Ｓ）－２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チア

ゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
メチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボン酸、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）プロパン－２－オール、
１－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オン、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オン、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
（Ｒ）－１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
（Ｓ）－１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）酢酸、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフ

ルオロエトキシ）アセトアミド、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）プロパン－２－オール、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）プロパン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（ジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロブタン－１－カルボニトリル、
２－（３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロブチル）プロパン－２－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２－メチルプロパン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）シクロプロパン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）シクロプロパン－１－オール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２－メチルプロパン－２－オール、
３－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２，３－ジメチルブタン－２－オール、

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－メトキシシクロプロピル）メトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシシクロプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２－メチルプロパン－２－オール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロブタン－１－オール、
１－（（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）メチル）シクロプロパン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
４－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－４，４－ジフルオロ－２－メチルブタン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）シクロプロパン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｒ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
（Ｓ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
４－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロヘキサン－１－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－４，４，４－トリフルオロ－２－メチルブタン－２－オール、
４－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）テトラヒドロ－２Ｈ－チオピラン　１，１－ジオキシド、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１

Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（（Ｓ）－テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（（Ｒ）－テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（オキセタン－３－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロ－２－メチルプロパン－１，２－ジオール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（ピリミジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（イソチアゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（３

－メチル－１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（（トリフルオロメチル）スルホニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボニトリル、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピリジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピリミジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピラジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（６－メチル－４－（トリフルオロメチル）ピリダジン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（６－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）メタノール、
（６－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－５－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル）メタノール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（（５－（トリフルオロメトキシ）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－シクロプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）チオ）エタン－１－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）スルフィニル）エタン－１－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）スルホニル）エタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（１，１－ジフルオロアリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（５－（メチルスルホニル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－シクロプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－エチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（モルホリノ）メタノン、
（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（ピロリジン－１－イル）メタノン、
Ｎ－ベンジル－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－３－メチルブタン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（５－クロロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
（Ｒ）－３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロ－２－メチルプロパン－１，２－ジオール、
（Ｓ）－３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロ－２－メチルプロパン－１，２－ジオール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボン酸、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド、
３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－モルホリノ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロプロパン－１，２－ジオール、
３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール、
（Ｒ）－３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾ

ール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール、
（Ｓ）－３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール、
３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール、
３－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
（２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）メタノール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２，２－ジオール、
（Ｒ）－３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
（Ｓ）－３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール、
３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピロリジン

－１－イルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（モルホリノスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１，１－ジフルオロ－２－メトキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１，１－ジフルオロ－２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロブタン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）ピペリジン－４－オール、
４－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）チオモルホリン　１，１－ジオキシド、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－ブロモ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１，１－ジフルオロプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
４－（ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イルジフルオロメトキシ）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（１，１－ジフルオロ－３－（ピリジン－３－イル）アリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルアセトアミド、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフル

オロ－Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－１－モルホリノエタン－１－オン、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロアセトアミド、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アセトアミド、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－１－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）エタン－１－オン、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－シクロブチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピロリジン－１－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
（６－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）メタノール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボニトリル、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（ピリジン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－シクロブトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール。

【００８１】

本発明において、前記一般式（１）で表される化合物は、遊離塩基の形態（遊離体）のほか、その薬理的に許容される塩であってもよい。前記薬理的に許容される塩としては、酸付加塩の形態であることが好ましく、前記酸付加塩の酸としては、例えば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸などのハロゲン化水素酸塩；硫酸、硝酸、リン酸、過酸化水素酸、炭酸などの無機酸塩；酢酸、トリクロロ酢酸、トリフルオロ酢酸、ヒドロキシ酢酸、乳酸、クエン酸、酒石酸、シュウ酸、安息香酸、マンデル酸、酪酸、マレイン酸、プロピオン酸、ギ酸、リンゴ酸などの有機カルボン酸塩；アスパラギン酸、グルタミン酸などの酸性アミノ酸；メタンスルホン酸などのアルキルスルホン酸；ｐ－トルエンスルホン酸などのアリールスルホン酸が挙げられる。

【００８２】

また、本発明に係る一般式（１）で表される化合物又はその薬理的に許容される塩は、置換基の種類に応じて、１又は２個以上の不斉炭素を有する場合があるが、１又は２個以上の不斉炭素に基づく光学活性体、ジアステレオ異性体、幾何異性体、互変異性体、それらの任意の混合物、ラセミ体などはいずれも本発明に係る一般式（１）で表される化合物又はその薬理的に許容される塩の範囲に包含される。また、本発明に係る一般式（１）で表される化合物又はその薬理的に許容される塩には、対応する水和物又は溶媒和物も含まれる。前記溶媒和物としては、例えば、２－プロパノール和物などが挙げられる。

【００８３】

さらに、本発明に係る一般式（１）で表される化合物又はその薬理的に許容される塩には、対応する放射性同位体や非放射性同位体でラベル化された化合物が含まれると共に、

それらの水和物及び溶媒和物も含まれる。

【００８４】

本明細書中において、上記の異性体や同位体が存在する化合物であって、その名称において特に言及が無い場合、その化合物はこれらの異性体や同位体うちの１種であっても２種以上の混合物であってもラセミ体であってもよい。

【００８５】

これらの一般式（１）で表される化合物又はその薬理的に許容される塩の中でも、本発明の治療剤としては、特に炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患の治療（さらに好ましくは、炎症性疾患、自己免疫疾患、及び線維化疾患）に有効である観点から、前記一般式（１１）で表される化合物及びその薬理的に許容される塩からなる群から選択される少なくとも１種を有効成分として含有することが好ましい。

【００８６】

さらに、本発明の治療剤としては、乾癬（関節症性乾癬、尋常性乾癬等）、鼻炎、アトピー性皮膚炎、アレルギー性結膜炎、ドライアイ、喘息、ＣＯＰＤ、ベーチェット病、炎症性腸疾患（クローン病や潰瘍性大腸炎等）、関節リウマチ、特発性肺線維症、非アルコール性脂肪性肝炎、筋ジストロフィー、円形脱毛症、白斑、化膿性汗腺炎、扁平苔癬、大腸がん、肺がん、血液がん、及び脳腫瘍からなる群から選択される少なくとも１種の疾患の治療により有効である傾向にある観点から、前記一般式（１１）で表される化合物が次の化合物：R^1が示す基が、上記のうち、ハロゲン原子、水酸基、及びC_{1-3}アルキルオキシ基のうちの少なくとも１種で置換されていてもよいC_{1-3}アルキル基；又はハロゲン原子及び水酸基のうちの少なくとも１種で置換されていてもよいC_{1-4}アルキルオキシ基であり、R^2が示す基が、上記のうち、水素原子；ハロゲン原子；ハロゲン原子、水酸基、及びC_{1-3}アルキルオキシ基のうちの少なくとも１種で置換されていてもよいC_{1-3}アルキル基；又はアセチル基である化合物、であることがより好ましく、乾癬（関節症性乾癬、尋常性乾癬等）、アトピー性皮膚炎、アレルギー性結膜炎、喘息、ＣＯＰＤ、関節リウマチ、特発性肺線維症、潰瘍性大腸炎、非アルコール性脂肪性肝炎、筋ジストロフィー、円形脱毛症、白斑、化膿性汗腺炎、扁平苔癬、大腸がん、肺がん、血液がん、及び脳腫瘍からなる群から選択される少なくとも１種の疾患の治療により有効であり、かつ、代謝安定性にも優れる傾向にある観点から、次の化合物：R^1が示す基が、上記のうち、ハロゲン原子及び水酸基のうちの少なくとも１種で置換されていてもよいC_{1-4}アルキルオキシ基であり、R^2が示す基が、上記のうち、水素原子である化合物、であることがさらに好ましい。

【００８７】

また、本発明の治療剤としては、前記一般式（１）で表される化合物及びその薬理的に許容される塩からなる群から選択される少なくとも１種の化合物のＰＤＥ４阻害活性が、ＰＤＥ４活性を５０％阻害する濃度（ＩＣ５０）で、１１ｎＭ以下であることが好ましく、１ｎＭ以下であることがより好ましい。前記ＩＣ５０が前記上限を超えると、炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患の治療効果が低下する傾向にある。

【００８８】

なお、本発明において、化合物（塩を含む）のＰＤＥ４阻害活性は、シンチレーション近接アッセイ法により測定することができ、より具体的には、反応用緩衝液（好ましくは、５０ｍＭ Ｔｒｉｓ－ＨＣｌ，ｐＨ７．４，８．３ｍＭ $MgCl_2$，１．７ｍＭ ＥＧＴＡ，３ｍｇ／ｍＬ ウシ血清アルブミン）で希釈した被験化合物１０μＬに、前記反応用緩衝溶液で３７５倍希釈したＰＤＥ４を５０μＬ加えた後、前記反応用緩衝溶液で１０００倍希釈した［２，８－^{3}Ｈ］－Ａｄｅｎｏｓｉｎｅ－３’，５’－ｃｙｃｌｉｃ ｐｈｏｓｐｈａｔｅ ｔｒｉｅｔｈｙｌａｍｍｏｎｉｕｍ ｓａｌｔ（基質）を４０μＬ加え、室温で１２０分間静置した後のＰＤＥ４反応生成物を測定し、ＰＤＥ４を加えずに反応用緩衝溶液のみを加えたものをブランク、被験化合物の代わりにジメチルスルホキシドのみを加えたものをコントロールとし、次式：

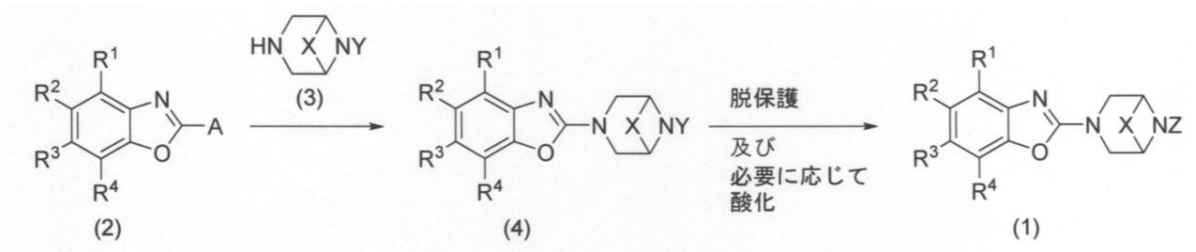
阻害率（％）＝｛１－（各被験化合物添加時の数値－ブランク値）／（コントロール

値－ブランク値）｝×１００
により、各被験化合物濃度と阻害率とから得られる阻害曲線より、阻害率が５０％となるときの被験化合物濃度を、ＰＤＥ４活性を５０％阻害する濃度（ＩＣ５０）として求めることができる。
【００８９】
また、本発明の治療剤としては、より具体的には、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
７－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール、
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チ

アゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール、
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール、
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール、
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール、
及びこれらの薬理的に許容される塩からなる群から選択される少なくとも１種を有効成分として含有することが好ましく、乾癬（関節症性乾癬、尋常性乾癬等）、アトピー性皮膚炎、アレルギー性結膜炎、ドライアイ、喘息、ＣＯＰＤ、関節リウマチ、特発性肺線維症、潰瘍性大腸炎、非アルコール性脂肪性肝炎、筋ジストロフィー、円形脱毛症、白斑、化膿性汗腺炎、扁平苔癬、大腸がん、肺がん、血液がん、及び脳腫瘍からなる群から選択される少なくとも１種の疾患の治療により有効であり、かつ、代謝安定性にも優れる傾向にある観点から、１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オールを有効成分として含有することが特に好ましい。

【００９０】
上記の本発明に係る化合物（前記一般式（１）で表される化合物、以下同様）及びその薬理的に許容される塩の製造方法は特に制限されず、市販の入手可能な、又は当業者によって認知される方法により合成可能な、出発原料、前駆体及び試薬及び溶媒などを用いて、当業者によって認知される幅広い様々な種類の合成法及び必要に応じて当該合成法に改良などを加えた方法などを組み合わせることによって製造できる。例えば、以下に示す代表的な方法により製造することができる。

【００９１】
【化５】



【００９２】
上記一般式（２）～（４）中、Ｒ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}及びＸは、好ましい態様も含めて、一般式（１）中のＲ^{1}、Ｒ^{2}、Ｒ^{3}、Ｒ^{4}及びＸとそれぞれ同義である。上記一般式（２）中、Ａはハロゲン原子、チオール基、ｐ－トルエンスルホニルオキシ基、トリフル

オロメタンスルホニルオキシ基、及びフェノキシ基などの脱離基を示し、上記一般式（３）中、Ｙはアミノ基の保護基を示し、上記一般式（４）中、Ｙは一般式（３）中のＹと同じ基を示す。前記アミノ基の保護基としては、例えば、Ｔ．Ｗ．Ｇｒｅｅｎｅ著の“Ｐｒｏｔｅｃｔｉｖｅ Ｇｒｏｕｐｓ ｉｎ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ（Ｊｏｈｎ Ｗｉｌｅｙ ａｎｄ Ｓｏｎｓ，１９９１年）”に記載されている、ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル基及びベンジルオキシカルボニル基などを用いることができる。

【００９３】

先ず、溶媒中において、一般式（２）で表される化合物を、一般式（２）で表される化合物のモル数に対して１当量～５０当量の一般式（３）で表される二環性ジアミンと反応させ、一般式（４）で表される化合物を得る。次いで、保護基であるＹを除去し（脱保護）、続いて必要に応じて酸化することにより、一般式（１）で表される化合物を得ることができる。本製造方法においては、上記反応で得られた一般式（４）で表される化合物において、保護基であるＹを脱保護することにより一般式（１）中のＺが水素原子である化合物を得ることができ、続いて酸化することにより一般式（１）中のＺが水酸基である化合物を得ることができる。

【００９４】

上記反応に用いられる溶媒としては、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジメトキシエタン、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドが挙げられる。上記反応において、反応温度は－７８～２００℃、好ましくは－７８～１５０℃の範囲から選ばれ、反応時間は５分～４８時間、好ましくは３０分～２０時間の範囲で行われる。また、上記反応を促進する目的又は温和な条件で反応を行う目的で、上記反応には、添加物（例えば、トリエチルアミン、Ｎ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミンなど）を適宜添加してもよい。

【００９５】

また、本製造方法においては、上記反応で得られた一般式（４）で表される化合物において、それぞれの置換基（R^1、R^2、R^3及びR^4）に官能基変換を施し、本発明に係る範囲内である別なる化合物に誘導することも可能である。例えば、金属触媒を用いた各種カップリング反応（例えば、熊田・玉尾・コリューカップリング、右田・小杉・スティルカップリング、鈴木・宮浦カップリング、根岸カップリング、バックワルド・ハートウィッグカップリング）、酸化反応、還元反応、アミド化反応、加水分解反応、カルボニル化合物に対する求核反応、アルキル化反応及び脱アルキル化反応などによる官能基の導入が挙げられる。

【００９６】

本発明の治療剤は、上記の本発明に係る化合物又はその薬理的に許容される塩を有効成分として含有する。これらの化合物は特に優れたＰＤＥ４阻害活性を有するため、ＰＤＥ４に起因する疾患の治療剤として有用であるが、特に、炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患からなる群から選択される少なくとも１種の疾患の治療剤として有用である。前記炎症性疾患としては、アレルギー性結膜炎、ドライアイ、鼻炎、アトピー性皮膚炎、喘息、ＣＯＰＤ、円形脱毛症、扁平苔癬等が挙げられ、前記自己免疫疾患としては、乾癬（関節症性乾癬、尋常性乾癬等）、ベーチェット病、炎症性腸疾患（クローン病、潰瘍性大腸炎等）、全身性エリテマトーデス、多発性硬化症、関節リウマチ、全身性強皮症、白斑、化膿性汗腺炎等が挙げられ、前記線維化疾患としては、間質性肺炎、特発性肺線維症、非アルコール性脂肪性肝炎、筋ジストロフィーが挙げられ、前記がん疾患としては、大腸がん、肺がん、血液がん、脳腫瘍が挙げられる。これらの中でも、本発明の治療剤は、乾癬（関節症性乾癬、尋常性乾癬等）、鼻炎、アトピー性皮膚炎、アレルギー性結膜炎、ドライアイ、喘息、ＣＯＰＤ、ベーチェット病、炎症性腸疾患（クローン病、潰瘍性大腸炎等）、関節リウマチ、特発性肺線維症、非アルコール性脂肪性肝炎、筋ジストロフィー、円形脱毛症、白斑、化膿性汗腺炎、扁平苔癬、大腸がん、肺がん、血液がん、及び脳腫瘍からなる群から選択される少なくとも１種の疾患の治療の治療のための治療剤としてより好ましく、乾癬（関節症性乾癬、尋常性乾癬等）、アトピー性皮膚炎、アレ

ルギー性結膜炎、喘息、ＣＯＰＤ、関節リウマチ、特発性肺線維症、潰瘍性大腸炎、非アルコール性脂肪性肝炎、筋ジストロフィー、円形脱毛症、白斑、化膿性汗腺炎、扁平苔癬、大腸がん、肺がん、血液がん、及び脳腫瘍からなる群から選択される少なくとも１種の疾患の治療のための治療剤として特に好ましい。

【００９７】

本発明の治療剤は、経口又は非経口のいずれの投与経路で投与してもよく、ヒト又はヒト以外の動物に投与することができる。したがって、本発明の治療剤は、投与経路に応じて適当な剤型の製剤とすることができる。前記製剤の例としては、具体的には、錠剤、丸剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤、エリキシル剤、懸濁剤、乳剤、及びシロップ剤などの経口剤、並びに、注射剤、吸入剤、直腸投与剤、坐剤、ローション剤、スプレー剤、軟膏剤、クリーム剤、貼付剤、及び徐放製剤などの非経口剤が挙げられる。

【００９８】

これらの各種製剤は、必要に応じて薬学の分野において通常用いられている担体、界面活性剤、分散剤、その他の製剤用補助剤（賦形剤、崩壊剤、結合剤、滑沢剤、着色剤等）を用い、常法により製造することができ、したがって、本発明の治療剤は、これらのうちの１種又は２種以上を組み合わせてさらに含有していてもよい。

【００９９】

前記担体としては、固体担体、液体担体、ガス状担体が挙げられる。前記固体担体としては、例えば、炭酸カルシウムが挙げられる。前記液体担体としては、例えば、メタノール、ｎ－ヘキサノール、エチレングリコール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類；ｎ－ヘキサン等の脂肪族炭化水素類；トルエン、キシレン、メチルナフタレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類；酢酸エチル等のエステル類；アセトニトリル、イソブチロニトリル等のニトリル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等の酸アミド類；ダイズ油、綿実油等の植物油類；ジメチルスルホキシド；水が挙げられる。また、前記ガス状担体としては、空気、窒素、炭酸ガス等が挙げられる。

【０１００】

乳化、分散、展着などのための界面活性剤及び分散剤としては、例えば、アルキル硫酸エステル類、アルキル（アリール）スルホン酸塩類、ポリオキシアルキレンアルキル（アリール）エーテル類、多価アルコールエステル類、リグニンスルホン酸塩が挙げられる。

【０１０１】

また、製剤の性状を改善するための補助剤としては、例えば、カルボキシメチルセルロース、アラビアガム、ポリエチレングリコール、ステアリン酸カルシウム、賦形剤、崩壊剤、結合剤、滑沢剤、着色剤が挙げられる。

【０１０２】

本発明の治療剤において、本発明に係る化合物又はその薬理的に許容される塩の含有量（本発明に係る化合物の含有量、又はその薬理学的に許容される塩の含有量、或いは、これらの混合物である場合にはその合計含有量）は、その投与目的や製剤の剤型などに応じて適宜調整するものであるため一概にはいえないが、通常、遊離体換算で、治療剤の全質量を基準として０．０１～７０質量％、好ましくは０．０５～５０質量％である。

【０１０３】

また、本発明の治療剤の投与量は、患者の年齢、体重、性別、疾患の相違、症状の程度などを考慮して、個々の場合に応じて適宜決定されるものであるため一概にはいえないが、通常、本発明に係る化合物又はその薬理的に許容される塩（本発明に係る化合物、又はその薬理学的に許容される塩、或いは、これらの混合物である場合にはその合計）の遊離体換算で、成人１日当り０．０１～１０００ｍｇ、好ましくは０．１～３００ｍｇであり、これを１日１回又は数回に分けて投与することができる。

【実施例】

【０１０４】

以下、本発明について、実施例を用いてより詳しく説明するが、本発明はこれら実施例

に限定されるものではない。また、実施例で使用する原料化合物の製造法を参考例として説明するが、これらも本発明の実施について具体的に説明するための例示であって、当該例示によって本発明の範囲が制限されるものではなく、本発明の範囲を逸脱しない範囲で種々の応用、変形及び修正などが可能であることは自明のことである。

【０１０５】

以下、実施例及び参考例における略語は、下記の意味である。

Ｍ：ｍｏｌ／Ｌ
ＤＭＳＯ：ジメチルスルホキシド
ＤＭＰＵ：Ｎ，Ｎ’－ジメチルプロピレン尿素
ＥＳＩ：電子スプレーイオン化法
ｅｅ：エナンチオマー過剰率
ＨＰＬＣ：高速液体クロマトグラフィー
ｍＣＰＢＡ：メタクロロ過安息香酸
ＭＳ：質量スペクトル
ｎ：ノルマル
ｓｅｃ：セカンダリー
ｔｅｒｔ：ターシャリー
ＴＬＣ：薄層クロマトグラフィー
ＵＶ：紫外
ＬＣ－ＭＳ：液体クロマトグラフ質量分析

（参考例１）

７－ブロモ－５－イソプロピルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール

（ａ）２－ブロモ－４－イソプロピル－６－ニトロフェノール

２－ブロモ－４－イソプロピルフェノール２．５ｇをジクロロメタン（５０ｍＬ）に溶解し、０℃にて濃硫酸（０．８ｍＬ，１．３当量）を５分かけて滴下し、その後７０％硝酸（０．７ｍＬ，１．０当量）を５分かけて加え、室温で２時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、固体の重曹を加えｐＨを７に調節した。反応液を濾過し、濾液を酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた表題の化合物を粗生成物として２．８ｇ得た。

ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２６０（Ｍ－Ｈ）$^-$

（ｂ）２－アミノ－６－ブロモ－４－イソプロピルフェノール

亜ジチオン酸ナトリウム（９．４ｇ，５当量）を蒸留水（３２ｍＬ）に０℃で溶解し、参考例１（ａ）で得られた２－ブロモ－４－イソプロピル－６－ニトロフェノール２．８ｇのエタノール（１２ｍＬ）溶液を１０分かけて滴下した。室温に昇温後２時間攪拌し、ＴＬＣで生成物を確認した。反応液を濾過し、固体をエタノールで洗浄した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣に蒸留水２０ｍＬを加え０℃で１５分攪拌した。得られた固体を濾取し、蒸留水で洗浄後、減圧乾燥して表題の化合物を１．９ｇ得た。

ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２２８（Ｍ－Ｈ）$^-$

（ｃ）７－ブロモ－５－イソプロピルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール

参考例１（ｂ）で得られた２－アミノ－６－ブロモ－４－イソプロピルフェノール１．９ｇをエタノール（１４ｍＬ）に溶解し、０．５Ｍ水酸化カリウムのエタノール溶液（７．４ｍＬ）と二硫化炭素（２．３ｍＬ，５当量）を加え、５０℃で４時間加熱した。ＴＬＣで生成物を確認した後、蒸留水（４ｍＬ）と６Ｍ塩酸（４ｍＬ）を室温で加えた。得られた固体を濾取し、減圧乾燥して表題の化合物を１．５ｇ得た。

【０１０６】

（参考例２）

７－ブロモ－４－メチルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール

（ａ）６－ブロモ－３－メチル－２－ニトロフェノール

粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝９５：５）で精製した以外は参考例１（ａ）と同様の方法を用いて、２－ブロモ－５－メチルフェノ

ール２．５ｇから表題の化合物を１．５ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２３０（Ｍ－Ｈ）$^-$
（ｂ）２－アミノ－６－ブロモ－３－メチルフェノール
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例２（ａ）で得られた６－ブロモ－３－メチル－２－ニトロフェノール１．５ｇから表題の化合物を６１０ｍｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２００（Ｍ－Ｈ）$^-$
（ｃ）７－ブロモ－４－メチルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例２（ｂ）で得られた２－アミノ－６－ブロモ－３－メチルフェノール６１０ｍｇから表題の化合物を３６０ｍｇ得た。
【０１０７】
（参考例３）
７－ブロモ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
（ａ）６－ブロモ－２－ニトロ－３－（トリフルオロメトキシ）フェノール
参考例１（ａ）と同様の方法を用いて、２－ブロモ－５－（トリフルオロメトキシ）フェノール３０ｇから表題の化合物を粗生成物として３６ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３００（Ｍ－Ｈ）$^-$
（ｂ）２－アミノ－６－ブロモ－３－（トリフルオロメトキシ）フェノール
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例３（ａ）で得られた６－ブロモ－２－ニトロ－３－（トリフルオロメトキシ）フェノール３６ｇから表題の化合物を１８ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２７２（Ｍ＋Ｈ）$^+$
（ｃ）７－ブロモ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例３（ｂ）で得られた２－アミノ－６－ブロモ－３－（トリフルオロメトキシ）フェノール２１ｇから表題の化合物を９．５ｇ得た。
【０１０８】
（参考例４）
７－ブロモ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
（ａ）６－ブロモ－２－ニトロ－３－（トリフルオロメチル）フェノール
参考例１（ａ）と同様の方法を用いて、２－ブロモ－５－（トリフルオロメチル）フェノール５ｇから表題の化合物を粗生成物として５．２ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２８４（Ｍ－Ｈ）$^-$
（ｂ）２－アミノ－６－ブロモ－３－（トリフルオロメチル）フェノール
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例４（ａ）で得られた６－ブロモ－２－ニトロ－３－（トリフルオロメチル）フェノール５．２ｇから表題の化合物を１．７ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２５６（Ｍ＋Ｈ）$^+$
（ｃ）７－ブロモ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例４（ｂ）で得られた２－アミノ－６－ブロモ－３－（トリフルオロメチル）フェノール１．７ｇから表題の化合物を４００ｍｇ得た。
【０１０９】
（参考例５）
Ｎ－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）アセトアミド
（ａ）Ｎ－（４－ブロモ－３－ヒドロキシフェニル）アセトアミド
Ｎ－（３－ヒドロキシフェニル）アセトアミド１０ｇを酢酸（８０ｍＬ）に溶解し、臭素の酢酸溶液（４．１ｍＬ，１．２当量）を加え室温で１６時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、反応液を氷冷の蒸留水に注ぎ込んだ。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝３：２

）で精製して、表題の化合物を４ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２３０（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｂ）Ｎ－（４－ブロモ－３－ヒドロキシ－２－ニトロフェニル）アセトアミド
参考例５（ａ）で得られたＮ－（４－ブロモ－３－ヒドロキシフェニル）アセトアミド６．１ｇを濃硫酸（１４０ｍＬ）に溶解し、０℃にて濃硫酸（７１ｍＬ）と７０％硝酸（１．４ｍＬ，１．２当量）の混合液を２５分かけて加え、室温で２時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、反応液を氷冷の蒸留水に注ぎ込んだ。これを酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として６．９ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２７３（Ｍ－Ｈ）$^{-}$
（ｃ）Ｎ－（２－アミノ－４－ブロモ－３－ヒドロキシフェニル）アセトアミド
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例５（ｂ）で得られたＮ－（４－ブロモ－３－ヒドロキシ－２－ニトロフェニル）アセトアミド６．９ｇから表題の化合物を５ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２４５（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｄ）Ｎ－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）アセトアミド
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例５（ｃ）で得られたＮ－（２－アミノ－４－ブロモ－３－ヒドロキシフェニル）アセトアミド５ｇから表題の化合物を２．５ｇ得た。
【０１１０】
（参考例６）
７－ブロモ－４－クロロベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
（ａ）６－ブロモ－３－クロロ－２－ニトロフェノール
参考例１（ａ）と同様の方法を用いて、２－ブロモ－５－クロロフェノール２．５ｇから表題の化合物を粗生成物として３．１ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２５２（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｂ）２－アミノ－６－ブロモ－３－クロロフェノール
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例６（ａ）で得られた６－ブロモ－３－クロロ－２－ニトロフェノール３．１ｇから表題の化合物を３．３ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２２２（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｃ）７－ブロモ－４－クロロベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例６（ｂ）で得られた２－アミノ－６－ブロモ－３－クロロフェノール３．３ｇから表題の化合物を１．８ｇ得た。
【０１１１】
（参考例７）
７－ブロモ－５－（メチルチオ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
（ａ）２－ブロモ－４－（メチルチオ）フェノール
４－（メチルチオ）フェノール２．５ｇをジクロロメタン（５０ｍＬ）に溶解し、４７％臭化水素酸（７．８ｍＬ，８当量）を加え４５℃に加熱し、３０％過酸化水素水（０．８４ｍＬ，２当量）を滴下し、その温度で６時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、反応液を氷冷の蒸留水に注ぎ込んだ。酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として３．５ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２１９（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｂ）２－ブロモ－４－（メチルチオ）－６－ニトロフェノール
参考例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例７（ａ）で得られた２－ブロモ－４－（メチルチオ）フェノール３．５ｇから表題の化合物を粗生成物として１．５ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２６４（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｃ）２－アミノ－６－ブロモ－４－（メチルチオ）フェノール

参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例７（ｂ）で得られた２－ブロモ－４－（メチルチオ）－６－ニトロフェノール３．８ｇから表題の化合物を３．２ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２３４（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｄ）７－ブロモ－５－（メチルチオ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例７（ｃ）で得られた２－アミノ－６－ブロモ－４－（メチルチオ）フェノール３．２ｇから表題の化合物を２．４ｇ得た。
【０１１２】
（参考例８）
７－ブロモ－５－（メチルスルフィニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
（ａ）２－ブロモ－４－（メチルスルフィニル）フェノール
粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製を行ったこと以外は、参考例９（ａ）と同様の方法を用いて、４－（メチルスルフィニル）フェノール１ｇから表題の化合物を３００ｍｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２３５（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｂ）２－ブロモ－４－（メチルスルフィニル）－６－ニトロフェノール
参考例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例８（ａ）で得られた２－ブロモ－４－（メチルスルフィニル）フェノール３．５ｇから表題の化合物を粗生成物として２ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２８１（Ｍ＋２Ｈ）$^{+}$
（ｃ）２－アミノ－６－ブロモ－４－（メチルスルフィニル）フェノール
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例８（ｂ）で得られた２－ブロモ－４－（メチルスルフィニル）－６－ニトロフェノール３．８ｇから表題の化合物を３．２ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２５０（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｄ）７－ブロモ－５－（メチルスルフィニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例８（ｃ）で得られた２－アミノ－６－ブロモ－４－（メチルスルフィニル）フェノール３．２ｇから表題の化合物を２．５ｇ得た。
【０１１３】
（参考例９）
Ｎ－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド
（ａ）Ｎ－（３－ブロモ－４－ヒドロキシフェニル）アセトアミド
Ｎ－（４－ヒドロキシフェニル）アセトアミド１ｇ及びクロロトリメチルシラン（０．１６ｍＬ，０．２当量）をアセトニトリル（２０ｍＬ）に溶解し、０℃でＮ－ブロモスクシンイミド（１．２９ｇ，１．１当量）を加え室温で１４時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、反応液を氷冷の蒸留水に注ぎ込んだ。これを酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝３：２）で精製して、表題の化合物を１ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２３０（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｂ）Ｎ－（３－ブロモ－４－ヒドロキシ－５－ニトロフェニル）アセトアミド
参考例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例９（ａ）で得られたＮ－（３－ブロモ－４－ヒドロキシフェニル）アセトアミド１．６ｇから表題の化合物を粗生成物として２ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２７５（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｃ）Ｎ－（３－アミノ－５－ブロモ－４－ヒドロキシフェニル）アセトアミド
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例９（ｂ）で得られたＮ－（３－ブロモ－４－ヒドロキシ－５－ニトロフェニル）アセトアミド２ｇから表題の化合物を１．２ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２４５（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$

（ｄ）Ｎ－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド

参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例９（ｃ）で得られたＮ－（３－アミノ－５－ブロモ－４－ヒドロキシフェニル）アセトアミド１．２ｇから表題の化合物を６５０ｍｇ得た。

【０１１４】

（参考例１０）

７－ブロモ－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール

（ａ）２－ブロモ－６－ニトロ－４－（トリフルオロメトキシ）フェノール

参考例１（ａ）と同様の方法を用いて、２－ブロモ－４－（トリフルオロメトキシ）フェノール５．２ｇから表題の化合物を粗生成物として５．８ｇ得た。

ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３００（Ｍ－Ｈ）$^-$

（ｂ）２－アミノ－６－ブロモ－４－（トリフルオロメトキシ）フェノール

参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例１０（ａ）で得られた２－ブロモ－６－ニトロ－４－（トリフルオロメトキシ）フェノール５．８ｇから表題の化合物を４．４ｇ得た。

ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２７２（Ｍ＋Ｈ）$^+$

（ｃ）７－ブロモ－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール

参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例１０（ｂ）で得られた２－アミノ－６－ブロモ－４－（トリフルオロメトキシ）フェノール４．４ｇから表題の化合物を５．０ｇ得た。

【０１１５】

（参考例１１）

７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド

（ａ）３－ブロモ－４－メトキシベンゼンスルホニルクロリド

１－ブロモ－２－メトキシベンゼン１０ｇをクロロホルム（５６ｍＬ）に溶解し、－１０℃で塩化スルホン酸（１１ｍＬ，３当量）を加え、室温で１時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、反応液を氷冷の蒸留水に注ぎ込んだ。これを酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として１４ｇ得た。

ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２８５（Ｍ＋Ｈ）$^+$

（ｂ）３－ブロモ－４－メトキシベンゼンスルホンアミド

参考例１１（ａ）で得られた３－ブロモ－４－メトキシベンゼンスルホニルクロリド１４ｇをジクロロメタン（１０００ｍＬ）に溶解し、０．５Ｍアンモニアの１，４－ジオキサン溶液（５１８ｍＬ）及びトリエチルアミン（２６ｍＬ）を０℃で加え、室温で２時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、５％クエン酸水溶液を加え反応を停止した。溶液を酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として１１．４ｇ得た。

ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２６６（Ｍ＋Ｈ）$^+$

（ｃ）３－ブロモ－４－ヒドロキシベンゼンスルホンアミド

参考例１１（ｂ）で得られた３－ブロモ－４－メトキシベンゼンスルホンアミド５ｇをジクロロメタン（１０００ｍＬ）に溶解し、１Ｍ三臭化ホウ素のジクロロメタン溶液（５６ｍＬ，３当量）を－７８℃で加え、室温で３６時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、蒸留水を加え反応を停止し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として４ｇ得た。

ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２５２（Ｍ＋Ｈ）$^+$

（ｄ）３－ブロモ－４－ヒドロキシ－５－ニトロベンゼンスルホンアミド

参考例５（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例１１（ｃ）で得られた３－ブロモ－４－ヒドロキシベンゼンスルホンアミド２．５ｇから表題の化合物を粗生成物として２．４ｇ

得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２９７（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｅ）３－アミノ－５－ブロモ－４－ヒドロキシベンゼンスルホンアミド
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例１１（ｄ）で得られた３－ブロモ－４－ヒドロキシ－５－ニトロベンゼンスルホンアミド５．６ｇから表題の化合物を粗生成物として１．５ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２６７（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｆ）７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例１１（ｅ）で得られた３－アミノ－５－ブロモ－４－ヒドロキシベンゼンスルホンアミド１．５ｇから表題の化合物を６００ｍｇ得た。
【０１１６】
（参考例１２）
７－ブロモ－５－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
（ａ）２－ブロモ－４－メトキシ－６－ニトロフェノール
２－ブロモ－４－メトキシフェノール２．５ｇを酢酸エチル（１２５ｍＬ）に溶解し、０℃にて７０％硝酸（０．８ｍＬ，１．０当量）を１０分かけて加え、室温で１０時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、固体の重曹を加えｐＨを７に調節した。反応液を濾過し、濾液を酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた表題の化合物を粗生成物として２．８ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２４８（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｂ）２－アミノ－６－ブロモ－４－メトキシフェノール
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例１２（ａ）で得られた２－ブロモ－４－メトキシ－６－ニトロフェノール１．２ｇから表題の化合物を１ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２１８（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｃ）７－ブロモ－５－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例１２（ｂ）で得られた２－アミノ－６－ブロモ－４－メトキシフェノール１ｇから表題の化合物を６００ｍｇ得た。
【０１１７】
（参考例１３）
７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
（ａ）１－（ベンジルオキシ）－４－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゼン
４－（ベンジルオキシ）フェノール５ｇをＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（４０ｍＬ）に溶解し、炭酸カリウム（１０．３ｇ，３当量）及びｐ－トルエンスルホン酸２，２，２－トリフルオロエチル（６．３ｇ，２当量）を加え、１１０℃で２２時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、蒸留水を加え反応を停止し、酢酸エチルで抽出した。有機層を蒸留水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝９８：２）で精製して、表題の化合物を４ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２８３（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｂ）４－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）フェノール
参考例１３（ａ）で得られた１－（ベンジルオキシ）－４－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゼン５００ｍｇをエタノール（１０ｍＬ）に溶解し、１０％Ｐｄ／Ｃ（３００ｍｇ）をアルゴン気流下で加えた。反応液を１気圧の水素雰囲気下に置き換えて室温で１７時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、反応液をセライト濾過した。濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：１９１（Ｍ－Ｈ）$^{-}$
（ｃ）２－ブロモ－４－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）フェノール
参考例９（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１３（ｂ）で得られた４－（２，２，２

－トリフルオロエトキシ）フェノール１．２ｇから表題の化合物を粗生成物として１．９ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２７１（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｄ）２－ブロモ－６－ニトロ－４－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）フェノール
参考例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１３（ｃ）で得られた２－ブロモ－４－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）フェノール５．１ｇから表題の化合物を粗生成物として５．２ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３１４（Ｍ－Ｈ）$^{-}$
（ｅ）２－アミノ－６－ブロモ－４－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）フェノール
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例１３（ｄ）で得られた２－ブロモ－６－ニトロ－４－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）フェノール６３４ｍｇから表題の化合物を４００ｍｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２８６（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｆ）７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例１３（ｅ）で得られた２－アミノ－６－ブロモ－４－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）フェノール４ｇから表題の化合物を２．１ｇ得た。
【０１１８】
（参考例１４）
７－ブロモ－４－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
（ａ）３－メトキシ－２－ニトロフェノール
２－ニトロベンゼン－１，３－ジオール５ｇをＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（７５ｍＬ）に溶解し、０℃で炭酸カリウム（１．３ｇ，０．３当量）及びメチルヨージド（２．２３ｍＬ，１．１当量）を加え、室温で３０分攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、蒸留水を加え反応を停止し、酢酸エチルで抽出した。有機層を２Ｍ塩酸（２０ｍＬ）で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝８５：１５）で精製して、表題の化合物を１．６ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：１６８（Ｍ－Ｈ）$^{-}$
（ｂ）６－ブロモ－３－メトキシ－２－ニトロフェノール
参考例９（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１４（ａ）で得られた３－メトキシ－２－ニトロフェノール２５０ｍｇから表題の化合物を１６６ｍｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２４８（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｃ）２－アミノ－６－ブロモ－３－メトキシフェノール
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例１４（ｂ）で得られた６－ブロモ－３－メトキシ－２－ニトロフェノール６．７ｇから表題の化合物を１ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２１８（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｄ）７－ブロモ－４－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例１４（ｃ）で得られた２－アミノ－６－ブロモ－３－メトキシフェノール１ｇから表題の化合物を６３５ｍｇ得た。
【０１１９】
（参考例１５）
エチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート
（ａ）エチル　３－ブロモ－４－ヒドロキシベンゾエート
３－ブロモ－４－ヒドロキシ安息香酸５ｇをエタノール（６０ｍＬ）に溶解し、０℃にて濃硫酸（７．３ｍＬ，６当量）を加え９０℃で２４時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、反応液を減圧濃縮して得られた残渣を酢酸エチルに溶解させ、飽和重曹水を加えた。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥して、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝７０：３０

）で精製して、表題の化合物を５．４ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２４５（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｂ）エチル　３－ブロモ－４－ヒドロキシ－５－ニトロベンゾエート
参考例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１５（ａ）で得られたエチル　３－ブロモ－４－ヒドロキシベンゾエート５．４ｇから表題の化合物を粗生成物として６．０ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２９０（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｃ）エチル　３－アミノ－５－ブロモ－４－ヒドロキシベンゾエート
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例１５（ｂ）で得られたエチル　３－ブロモ－４－ヒドロキシ－５－ニトロベンゾエート６．０ｇから表題の化合物を４．０ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２６０（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｄ）エチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例１５（ｃ）で得られたエチル　３－アミノ－５－ブロモ－４－ヒドロキシベンゾエート４．０ｇから表題の化合物を４．１ｇ得た。
【０１２０】
（参考例１６）
エチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
（ａ）４－ブロモ－３－ヒドロキシ－２－ニトロ安息香酸
参考例５（ｂ）と同様の方法を用いて、４－ブロモ－３－ヒドロキシ安息香酸２．５ｇから表題の化合物を粗生成物として２．７ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２６２（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｂ）エチル　４－ブロモ－３－ヒドロキシ－２－ニトロベンゾエート
参考例１５（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１６（ａ）で得られた４－ブロモ－３－ヒドロキシ－２－ニトロ安息香酸２．７ｇから表題の化合物を粗生成物として１．３ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２８８（Ｍ－Ｈ）$^{-}$
（ｃ）エチル　２－アミノ－４－ブロモ－３－ヒドロキシベンゾエート
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例１６（ｂ）で得られたエチル　４－ブロモ－３－ヒドロキシ－２－ニトロベンゾエート１．３ｇから表題の化合物を５８０ｍｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２６０（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｄ）エチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例１６（ｃ）で得られたエチル　２－アミノ－４－ブロモ－３－ヒドロキシベンゾエート５８０ｍｇから表題の化合物を２４５ｍｇ得た。
【０１２１】
（参考例１７）
（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール
参考例１６で得られたエチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート５００ｍｇをテトラヒドロフラン１０ｍＬに溶解し、０℃で水素化リチウムアルミニウムの１．０Ｍテトラヒドロフラン溶液（２．４ｍＬ，１．５当量）を加え、室温で２時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え反応を停止し、酢酸エチルで抽出した。水層を１Ｍ塩酸水溶液で酸性とし、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を混合した後、蒸留水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として２４０ｍｇ得た。

【０１２２】
（参考例１８）
１－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール
（ａ）１－（３－ブロモ－４－メトキシフェニル）－２，２，２－トリフルオロエタノン
２，２，２－トリフルオロ－１－（４－メトキシフェニル）エタン－１－オン１ｇを四塩化炭素（９．５ｍＬ）に溶解し、酸化銀（ＩＩ）（７２ｍｇ，０．１２当量）、濃硫酸（０．４７ｍＬ）及び臭素（０．２６ｍＬ，１．０３当量）を加え６５℃で１７時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、反応液を氷冷の蒸留水に注ぎ込んだ。ジクロロメタンで抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝９５：５）で精製して、表題の化合物を１．３ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２８３（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｂ）１－（３－ブロモ－４－ヒドロキシフェニル）－２，２，２－トリフルオロエタノン
参考例１８（ａ）で得られた１－（３－ブロモ－４－メトキシフェニル）－２，２，２－トリフルオロエタノン１．３ｇをＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１３ｍＬ）に溶解し、塩化リチウム（７０１ｍｇ，３．６当量）を加え１４０℃で２時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、反応液を減圧濃縮し得られた残渣をメタノールに溶解し、塩酸のメタノール溶液を用いてｐＨを３に調節した。再度、混合液を減圧濃縮し得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝４：１）で精製して、表題の化合物を１．１ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２６９（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｃ）１－（３－ブロモ－４－ヒドロキシ－５－ニトロフェニル）－２，２，２－トリフルオロエタノン
参考例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１８（ｂ）で得られた１－（３－ブロモ－４－ヒドロキシフェニル）－２，２，２－トリフルオロエタノン１．１ｇから表題の化合物を粗生成物として１．０ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３１２（Ｍ－Ｈ）$^{-}$
（ｄ）２－ブロモ－６－ニトロ－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）フェノール
参考例１８（ｃ）で得られた１－（３－ブロモ－４－ヒドロキシ－５－ニトロフェニル）－２，２，２－トリフルオロエタノン１．０ｇをメタノール（１０ｍＬ）に溶解し、０℃で水素化ホウ素ナトリウム（１２９ｍｇ，１．１当量）を加え、その温度で１時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、氷冷の蒸留水を加え反応を停止し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として９００ｍｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３１４（Ｍ－Ｈ）$^{-}$
（ｅ）２－アミノ－６－ブロモ－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）フェノール
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例１８（ｄ）で得られた２－ブロモ－６－ニトロ－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）フェノール９００ｍｇから表題の化合物を６５０ｍｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２８４（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$
（ｆ）１－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例１８（ｅ）で得られた２－アミノ－６－ブロモ－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）フェノール９２５ｍｇから表題の化合物を７００ｍｇ得た。
【０１２３】

（参考例１９）
エチル　７－ブロモ－２－メルカプト－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート
（ａ）５－ブロモ－４－ヒドロキシ－２－（トリフルオロメチル）安息香酸
参考例７（ａ）と同様の方法を用いて、４－ヒドロキシ－２－（トリフルオロメチル）安息香酸５．０ｇから表題の化合物を粗生成物として３．８ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２８３（Ｍ－Ｈ）$^-$
（ｂ）エチル　５－ブロモ－４－ヒドロキシ－２－（トリフルオロメチル）ベンゾエート
シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製を行っていないこと以外は、参考例１５（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１９（ａ）で得られた５－ブロモ－４－ヒドロキシ－２－（トリフルオロメチル）安息香酸３．８ｇから表題の化合物を粗生成物として３．８ｇ得た。
（ｃ）エチル　５－ブロモ－４－ヒドロキシ－３－ニトロ－２－（トリフルオロメチル）ベンゾエート
参考例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１９（ｂ）で得られたエチル　５－ブロモ－４－ヒドロキシ－２－（トリフルオロメチル）ベンゾエート３．８ｇから表題の化合物を粗生成物として３．８ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３５９（Ｍ＋２Ｈ）$^+$
（ｄ）エチル　３－アミノ－５－ブロモ－４－ヒドロキシ－２－（トリフルオロメチル）ベンゾエート
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例１９（ｃ）で得られたエチル　５－ブロモ－４－ヒドロキシ－３－ニトロ－２－（トリフルオロメチル）ベンゾエート３．８ｇから表題の化合物を２．７ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３２８（Ｍ＋Ｈ）$^+$
（ｅ）エチル　７－ブロモ－２－メルカプト－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例１９（ｄ）で得られたエチル　３－アミノ－５－ブロモ－４－ヒドロキシ－２－（トリフルオロメチル）ベンゾエート２．７ｇから表題の化合物を１．６ｇ得た
（参考例２０）
エチル　７－ブロモ－２－メルカプト－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート
（ａ）トリイソプロピル（３－（トリフルオロメトキシ）フェノキシ）シラン
３－（トリフルオロメトキシ）フェノール５ｇ及びイミダゾール（５．７ｇ，３当量）をＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１３ｍＬ）に溶解し、クロロトリイソプロピルシラン（１２ｍＬ，２当量）を加え、室温で４時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、氷冷の蒸留水を加え反応を停止し、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン）で精製して、表題の化合物を８．１ｇ得た。
（ｂ）２－（トリフルオロメトキシ）－４－（（トリイソプロピルシリル）オキシ）安息香酸
参考例２０（ａ）で得られたトリイソプロピル（３－（トリフルオロメトキシ）フェノキシ）シラン８．１ｇ及びＮ，Ｎ，Ｎ’，Ｎ’－テトラメチルエチレンジアミン（３．６ｍＬ，１当量）をテトラヒドロフラン（１６２ｍＬ）に溶解し、－７８℃で１．５Ｍ　ｓｅｃ－ブチルリチウムのシクロヘキサン溶液（２４ｍＬ，１．５当量）を２０分かけて滴下した。その温度で２時間攪拌した後、－４０℃でさらに１時間攪拌した。反応液を－７８℃に冷却し、二酸化炭素ガスを２時間かけて加えた。０℃に昇温しＴＬＣで生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え反応を停止し、６Ｍ塩酸にてｐＨを２に調節した。反応液を酢酸エチルで抽出し有機層を蒸留水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として９ｇ得た。

ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３７７（Ｍ－Ｈ）$^-$
（ｃ）エチル　４－ヒドロキシ－２－（トリフルオロメトキシ）ベンゾエート
参考例１５（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２０（ｂ）で得られた２－（トリフルオロメトキシ）－４－（（トリイソプロピルシリル）オキシ）安息香酸９ｇから表題の化合物を２．３ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２４８（Ｍ－２Ｈ）$^-$
（ｄ）エチル　５－ブロモ－４－ヒドロキシ－２－（トリフルオロメトキシ）ベンゾエート
参考例９（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２０（ｃ）で得られたエチル　４－ヒドロキシ－２－（トリフルオロメトキシ）ベンゾエート３．６ｇから表題の化合物を３．１ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３２６（Ｍ－２Ｈ）$^-$
（ｅ）エチル　５－ブロモ－４－ヒドロキシ－３－ニトロ－２－（トリフルオロメトキシ）ベンゾエート
参考例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２０（ｄ）で得られたエチル　５－ブロモ－４－ヒドロキシ－２－（トリフルオロメトキシ）ベンゾエート１．４ｇから表題の化合物を粗生成物として２．４ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３７２（Ｍ－Ｈ）$^-$
（ｆ）エチル　３－アミノ－５－ブロモ－４－ヒドロキシ－２－（トリフルオロメトキシ）ベンゾエート
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例２０（ｅ）で得られたエチル　５－ブロモ－４－ヒドロキシ－３－ニトロ－２－（トリフルオロメトキシ）ベンゾエート２．４ｇから表題の化合物を１．５ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３４４（Ｍ＋Ｈ）$^+$
（ｇ）エチル　７－ブロモ－２－メルカプト－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例２０（ｆ）で得られたエチル　３－アミノ－５－ブロモ－４－ヒドロキシ－２－（トリフルオロメトキシ）ベンゾエート１．５ｇから表題の化合物を９８０ｍｇ得た。

【０１２４】

（参考例２１）
１－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール
（ａ）メチル　４－ブロモ－３－ヒドロキシベンゾエート
エタノールの代わりにメタノールを用いた以外は、参考例１５（ａ）と同様の方法を用いて、４－ブロモ－３－ヒドロキシ安息香酸５０ｇから表題の化合物を５２ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２３１（Ｍ＋Ｈ）$^+$
（ｂ）２－ブロモ－５－（ヒドロキシメチル）フェノール
参考例２１（ａ）で得られたメチル　４－ブロモ－３－ヒドロキシベンゾエート２６．８ｇをテトラヒドロフラン（５３７ｍＬ）に溶解し、０℃で水素化リチウムアルミニウム（６．６ｇ，１．５当量）を１５分かけて加え、室温で１７時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、０℃で飽和硫酸ナトリウム水溶液を加え反応を停止し、６Ｍ塩酸にてｐＨを２に調節した。反応液を酢酸エチルで抽出し有機層を蒸留水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝７：３）で精製して、表題の化合物を２０ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２０１（Ｍ－Ｈ）$^-$
（ｃ）４－ブロモ－３－ヒドロキシベンズアルデヒド
参考例２１（ｂ）で得られた２－ブロモ－５－（ヒドロキシメチル）フェノール４０ｇをジクロロメタン（４０００ｍＬ）に溶解し、０℃でセライト（１５０ｇ）及びクロロク

ロム酸ピリジニウム（１０６ｇ，２．５当量）を４５分かけて加え、室温で２時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、反応液を濾過しジクロロメタンで洗浄した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝７：３）で精製して、表題の化合物を２８ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２０１（Ｍ＋Ｈ）$^+$
（ｄ）２－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）フェノール
参考例２１（ｃ）で得られた４－ブロモ－３－ヒドロキシベンズアルデヒド１５ｇをＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（３００ｍＬ）に溶解し、０℃でトリフルオロメチルトリメチルシラン（３３ｍＬ，３当量）及び炭酸カリウム（３．１ｇ，０．３当量）を加え、室温で２．５時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、０℃で蒸留水を加え、室温で１５時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで抽出し有機層を蒸留水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝７：３）で精製して、表題の化合物を１６ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２７１（Ｍ＋Ｈ）$^+$
（ｅ）６－ブロモ－２－ニトロ－３－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）フェノール
参考例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２１（ｄ）で得られた２－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）フェノール２５ｇから表題の化合物を粗生成物として１８ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３１６（Ｍ＋Ｈ）$^+$
（ｆ）２－アミノ－６－ブロモ－３－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）フェノール
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例２１（ｅ）で得られた６－ブロモ－２－ニトロ－３－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）フェノール１８ｇから表題の化合物を１１．６ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２８６（Ｍ＋Ｈ）$^+$
（ｇ）１－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例２１（ｆ）で得られた２－アミノ－６－ブロモ－３－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）フェノール１１．６ｇから表題の化合物を６．３ｇ得た。
【０１２５】
（参考例２２）
メチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
（ａ）メチル　４－ブロモ－３－ヒドロキシ－２－ニトロベンゾエート
エタノールの代わりにメタノールを用いた以外は、参考例１５（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１６（ａ）で得られた４－ブロモ－３－ヒドロキシ－２－ニトロ安息香酸１３ｇから表題の化合物を粗生成物として１２．７ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２７６（Ｍ＋Ｈ）$^+$
（ｂ）メチル　２－アミノ－４－ブロモ－３－ヒドロキシベンゾエート
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例２２（ａ）で得られたメチル　４－ブロモ－３－ヒドロキシ－２－ニトロベンゾエート１２．７ｇから表題の化合物を５．４ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２４６（Ｍ＋Ｈ）$^+$
（ｃ）メチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例２２（ｂ）で得られたメチル　２－アミノ－４－ブロモ－３－ヒドロキシベンゾエート５．４ｇから表題の化合物を２．５ｇ得た

。

【０１２６】

（参考例２３）

４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール

（ａ）（（（２－ニトロ－１，３－フェニレン）ビス（オキシ））ビス（メチレン））ジベンゼン

２－ニトロレゾルシノール５ｇをＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（８８ｍＬ）に溶解し、ベンジルブロミド（８．４ｍＬ，２．２当量）及び炭酸セシウム（２５ｇ，２．４当量）を加え、室温で１２時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、酢酸エチルを加え１％塩酸水溶液で有機層を洗浄後、蒸留水で有機層を再度洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣にヘキサンを加え析出した固体を濾取して、表題の化合物を１０ｇ得た。

ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３３６（Ｍ＋Ｈ）$^{+}$

（ｂ）３－（ベンジルオキシ）－２－ニトロフェノール

参考例２３（ａ）で得られた（（（２－ニトロ－１，３－フェニレン）ビス（オキシ））ビス（メチレン））ジベンゼン１０ｇをジクロロメタン（２７０ｍＬ）に溶解し、－７８℃で三塩化ホウ素の１．０Ｍヘプタン溶液（４５ｍＬ，１．５当量）を加え、－７８℃で１時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、メタノールを１０分間かけて加え室温に昇温し、蒸留水を加えた。この混合物をジクロロメタンで２回抽出し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝９．５：０．５）で精製して、表題の化合物を４．７ｇ得た。

ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２４４（Ｍ－Ｈ）$^{-}$

（ｃ）３－（ベンジルオキシ）－６－ブロモ－２－ニトロフェノール

参考例９（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２３（ｂ）で得られた３－（ベンジルオキシ）－２－ニトロフェノール２０ｇから表題の化合物を２２ｇ得た。

ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３２２（Ｍ－Ｈ）$^{-}$

（ｄ）２－アミノ－３－（ベンジルオキシ）－６－ブロモフェノール

参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例２３（ｃ）で得られた３－（ベンジルオキシ）－６－ブロモ－２－ニトロフェノール２２ｇから表題の化合物を２８ｇ得た。

ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２９２（Ｍ－Ｈ）$^{-}$

（ｅ）４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール

参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例２３（ｄ）で得られた２－アミノ－３－（ベンジルオキシ）－６－ブロモフェノール２５ｇから表題の化合物を２８ｇ得た。

【０１２７】

（参考例２４）

７－ブロモ－４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール

（ａ）３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－ニトロフェノール

２－ニトロレゾルシノール５．０ｇ、イミダゾール（２．７ｇ，１．２当量）をテトラヒドロフラン（１６０ｍＬ）に溶解し、０℃でｔｅｒｔ－ブチルジメチルクロロシラン（４．９ｇ，１．０当量）を加え、室温で３０分攪拌し、その後６５℃で３時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、蒸留水を１０分間かけて加え反応を停止し、酢酸エチルで３回抽出した。得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥したものを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝９：１）で精製して、表題の化合物を４．０ｇ得た。

ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：２６８（Ｍ－Ｈ）$^{-}$

（ｂ）６－ブロモ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－ニトロフェノール

参考例９（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２４（ａ）で得られた３－（（ｔｅｒｔ

－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－ニトロフェノール４．０ｇから表題の化合物を３．６ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３４６（Ｍ－Ｈ）$^-$
（ｃ）２－アミノ－６－ブロモ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）フェノール
参考例１（ｂ）と同様の方法を用いて、参考例２４（ｂ）で得られた６－ブロモ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－２－ニトロフェノール３．６ｇから表題の化合物を３．０ｇ得た。
ＭＳ（ＥＳＩ）ｍ／ｚ：３１８（Ｍ＋Ｈ）$^+$
（ｄ）７－ブロモ－４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール
参考例１（ｃ）と同様の方法を用いて、参考例２４（ｃ）で得られた２－アミノ－６－ブロモ－３－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）フェノール３．０ｇから表題の化合物を２．５ｇ得た。
【０１２８】
（実施例１）
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール（国際公開第２０１５／００５４２９号の参考例１２の化合物）７００ｍｇ及びｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（５１２ｍｇ，１．２当量）をｍ－キシレン（５ｍＬ）に溶解し、１２０℃の油浴中にて一晩攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、１Ｍ水酸化ナトリウム水溶液を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝４：１）で精製して、表題の化合物を９６７ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
実施例１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５００ｍｇをトルエン（３．２ｍＬ）に溶解し、２－チアゾリルジンクブロミドの０．５Ｍテトラヒドロフラン溶液（３．８ｍＬ，２当量）及び１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンパラジウム（ＩＩ）ジクロリド・ジクロロメタン錯体（１５５ｍｇ，０．２当量）を加えアルゴン雰囲気下９０℃の油浴中にて６時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加えセライト濾過を行った。濾液を酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝４：１）で精製して、表題の化合物を４２４ｍｇ得た。
（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４２０ｍｇをクロロホルム（７．９ｍＬ）及びトリフルオロ酢酸（３ｍＬ）に溶解し、室温で３時間攪拌し

た。反応液に飽和重曹水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム～クロロホルム：メタノール：アンモニア水溶液＝４：１：０．１）で精製して、表題の化合物を３４０ｍｇ得た。

【０１２９】

（実施例２）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール２５０ｍｇから表題の化合物を２８０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１５０ｍｇ、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリド（１９ｍｇ，０．１当量）及び２－（トリブチルスタンニル）チアゾール（０．１２ｍＬ，２．０当量）を１，４－ジオキサンに溶解し、アルゴン雰囲気下１３０℃の油浴中にて２９時間撹拌した。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝９３：７）で精製して、表題の化合物を１００ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を１００ｍｇ得た。

【０１３０】

（実施例３）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール３００ｍｇから表題の化合物を３４７ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル

３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３４７ｍｇから表題の化合物を２７５ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル３－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２７５ｍｇから表題の化合物を１５７ｍｇ得た。

【０１３１】

（実施例４）

７－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　７－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール２５０ｍｇから表題の化合物を２８０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　７－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル７－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を１００ｍｇ得た。

（ｃ）７－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル７－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１５０ｍｇから表題の化合物を８０ｍｇ得た。

【０１３２】

（実施例５）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５５ｍｇ、１Ｈ－ピラゾール（１４ｍｇ，２当量）、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（０）（９．５ｍｇ，０．１当量）、２－ジ－ｔｅｒｔ－ブチルホスフィノ－３，４，５，６－テトラメチル－２

’，４’，６’－トリイソプロピルビフェニル（１２．５ｍｇ，０．２５当量）及びリン酸カリウム（４４ｍｇ，２当量）をトルエン（１．０ｍＬ）に溶解し、９０℃の油浴中にて２５時間攪拌した。反応液に蒸留水を加え酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝４：１）で精製して、表題の化合物を１０ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル３－（５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を３．８ｍｇ得た。

【０１３３】

（実施例６）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（フラン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（フラン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５３ｍｇ、２－（トリブチルスタンニル）フラン（４７．２μＬ，１．５当量）及びテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）（１１．６ｍｇ，０．１当量）をＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（０．５ｍＬ）に溶解し、マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製、条件：１００℃，１時間）にて攪拌した。反応液に蒸留水を加え酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝４：１）で精製して、表題の化合物を５６ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（フラン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル３－（５－クロロ－７－（フラン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５６ｍｇから表題の化合物を３５ｍｇ得た。

【０１３４】

（実施例７）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

２－（トリブチルスタンニル）フランに代えて２－（トリブチルスタンニル）ピリジンを用いた以外は実施例６（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５３ｍｇから表題の化合物を４６ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾー

ル
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル３－（５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４６ｍｇから表題の化合物を３１ｍｇ得た。
【０１３５】
（実施例８）
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
２－（トリブチルスタンニル）フランに代えて４－（トリブチルスタンニル）チアゾールを用いた以外は実施例６（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５３ｍｇから表題の化合物を６０ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル３－（５－クロロ－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート６０ｍｇから表題の化合物を４０ｍｇ得た。
【０１３６】
（実施例９）
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（オキサゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（オキサゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
２－（トリブチルスタンニル）フランに代えて２－（トリブチルスタンニル）オキサゾールを用いた以外は実施例６（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５３ｍｇから表題の化合物を５５ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（オキサゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル３－（５－クロロ－７－（オキサゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５５ｍｇから表題の化合物を３８ｍｇ得た。
【０１３７】
（実施例１０）
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］

オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２６３ｍｇ、ビス（ピナコラト）ジボロン（１９０ｍｇ，１．５当量）、酢酸カリウム（１４７ｍｇ，３当量）及び１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンパラジウム（ＩＩ）ジクロリド・ジクロロメタン錯体（４１ｍｇ，０．１当量）を１，４－ジオキサン（２．５ｍＬ）に溶解し、アルゴン雰囲気下９０℃の油浴中にて５時間攪拌した。反応液に蒸留水を加えセライト濾過を行った。濾液を酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝４：１～ヘキサン：酢酸エチル：メタノール４：１：０．５）で精製して、表題の化合物を２３４ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５７ｍｇ、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）（１１．６ｍｇ，０．１当量）、炭酸カリウム（５５ｍｇ，４当量）及び２－ブロモ－５－フルオロピリジン（３５ｍｇ，２当量）を１，４－ジオキサン（０．４ｍＬ）と蒸留水（０．１ｍＬ）の混合溶媒に溶解し、アルゴン雰囲気下１００℃の油浴中にて４時間攪拌した。反応液に蒸留水を加えセライト濾過を行った。濾液を酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝４：１）で精製して、表題の化合物を４７ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４７ｍｇから表題の化合物を３３ｍｇ得た。

【０１３８】

（実施例１１）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール（国際公開第２０１５／００５４２９号の参考例１０の化合物）２５０ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を３４５ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシク

ロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３４０ｍｇ、２－（トリブチルスタンニル）ピリジン（０．３２ｍＬ，１．５当量）及びビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリド（４６ｍｇ，０．１当量）を１，４－ジオキサン（７ｍＬ）に溶解し、１１０℃の油浴中にて４時間攪拌した。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝９３：７）で精製して、表題の化合物を４００ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４００ｍｇから表題の化合物を１５４ｍｇ得た。

【０１３９】

（実施例１２）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール６００ｍｇから表題の化合物を８６０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例１１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を粗生成物として３３３ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート３３０ｍｇから表題の化合物を１５０ｍｇ得た。

【０１４０】

（実施例１３）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール６５０ｍｇから表題の化合物を７００ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリ

フルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を粗生成物として３４０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３４０ｍｇから表題の化合物を１６０ｍｇ得た。

【０１４１】

（実施例１４）

７－（５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　７－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール６５０ｍｇから表題の化合物を９１４ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　７－（５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例１１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　７－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を２１４ｍｇ得た。

（ｃ）７－（５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　７－（５－クロロ－７－（ピリジン－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２１４ｍｇから表題の化合物を１５０ｍｇ得た。

【０１４２】

（実施例１５）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５７０ｍｇ、１Ｈ－ピラゾール（９１

ｍｇ，１．２当量）、ヨウ化銅（Ｉ）（２１ｍｇ，０．１当量）、ｔｒａｎｓ－Ｎ，Ｎ’－ジメチルシクロヘキサン－１，２－ジアミン（３１ｍｇ，０．２当量）及びリン酸カリウム（４９８ｍｇ，２．１当量）をトルエン（１８ｍＬ）に溶解し、１３０℃で２４時間撹拌した。反応液に飽和重曹水を加え酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝９４：６）で精製して、表題の化合物を１４０ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１４０ｍｇから表題の化合物を９８ｍｇ得た。

【０１４３】

（実施例１６）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例１５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート３７５ｍｇから表題の化合物を１９０ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１９０ｍｇから表題の化合物を１４０ｍｇ得た。

【０１４４】

（実施例１７）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４００ｍｇから表題の化合物を２４０ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプ

タン－６－カルボキシレート２４０ｍｇから表題の化合物を１７６ｍｇ得た。

【０１４５】

（実施例１８）

７－（５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　７－（５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例１５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　７－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２７０ｍｇから表題の化合物を１７０ｍｇ得た。

（ｂ）７－（５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　７－（５－クロロ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１７０ｍｇから表題の化合物を１２０ｍｇ得た。

【０１４６】

（実施例１９）

７－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　７－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　７－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１３５ｍｇから表題の化合物を６２ｍｇ得た。

（ｂ）７－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　７－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート６２ｍｇから表題の化合物を４１ｍｇ得た。

【０１４７】

（実施例２０）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－クロロ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を２０２ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０２ｍｇから表題の化合物を９４ｍｇ得た。

【０１４８】

（実施例２１）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－イソプロピルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

参考例１で得られた７－ブロモ－５－イソプロピルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１００ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を１４０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－イソプロピルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２４０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として３５０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３５０ｍｇから表題の化合物を２００ｍｇ得た。

【０１４９】

（実施例２２）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－イソプロピルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１で得られた７－ブロモ－５－イソプロピルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール２００ｍｇから表題の化合物を２９０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－イソプロピルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘ

プタン－６－カルボキシレート２４０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として４０９ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４０９ｍｇから表題の化合物を１６０ｍｇ得た。

【０１５０】

（実施例２３）

７－（５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　７－（７－ブロモ－５－イソプロピルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１で得られた７－ブロモ－５－イソプロピルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール２００ｍｇから表題の化合物を２６０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　７－（５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　７－（７－ブロモ－５－イソプロピルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２６０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として３８０ｍｇ得た。

（ｃ）７－（５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　７－（５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート３８０ｍｇから表題の化合物を１５５ｍｇ得た。

【０１５１】

（実施例２４）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－イソプロピルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１で得られた７－ブロモ－５－イソプロピルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール２００ｍｇから表題の化合物を３２０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－イソプロ

ピルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２６０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として３４０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－イソプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート３４０ｍｇから表題の化合物を１６０ｍｇ得た。

【０１５２】

（実施例２５）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－メチルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

参考例２で得られた７－ブロモ－４－メチルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１５０ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を２１０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－メチルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２１０ｍｇから表題の化合物を１７８ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１７５ｍｇから表題の化合物を１２０ｍｇ得た。

【０１５３】

（実施例２６）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－メチルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２で得られた７－ブロモ－４－メチルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１５０ｍｇから表題の化合物を２０５ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－メチルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０５ｍｇから表題の化合物を粗生成物として２５０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２６（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２５０ｍｇから表題の化合物を１４０ｍｇ得た。

【０１５４】

（実施例２７）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－メチルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２で得られた７－ブロモ－４－メチルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１５０ｍｇから表題の化合物を２２０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－メチルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２１０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として２３５ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２３５ｍｇから表題の化合物を１１９ｍｇ得た。

【０１５５】

（実施例２８）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

参考例３で得られた７－ブロモ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１００ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を１４０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１４０ｍｇから表題の化合物を１２０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チア

ゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１２０ｍｇから表題の化合物を９０ｍｇ得た。

【０１５６】

（実施例２９）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例３で得られた７－ブロモ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１５０ｍｇから表題の化合物を２００ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を粗生成物として２５０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２９（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２５０ｍｇから表題の化合物を１４０ｍｇ得た。

【０１５７】

（実施例３０）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例３で得られた７－ブロモ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１５０ｍｇから表題の化合物を２２０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２２０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として

３００ｍｇ得た。
（ｃ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を１４０ｍｇ得た。
【０１５８】
（実施例３１）
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
参考例４で得られた７－ブロモ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１５０ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を２００ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１３０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１３０ｍｇ得た。
（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１３０ｍｇから表題の化合物を１００ｍｇ得た。
【０１５９】
（実施例３２）
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例４で得られた７－ブロモ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１５０ｍｇから表題の化合物を１９０ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０

）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１３０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１７０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１７０ｍｇから表題の化合物を９８ｍｇ得た。

【０１６０】

（実施例３３）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例４で得られた７－ブロモ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１５０ｍｇから表題の化合物を２１０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１００ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を５０ｍｇ得た。

【０１６１】

（実施例３４）

Ｎ－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）アセトアミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－アセトアミド－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例５で得られたＮ－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）アセトアミド２５０ｍｇから表題の化合物を２８ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－アセトアミド－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９

－カルボキシレート
２－チアゾリルジンクブロミドの０．５Ｍテトラヒドロフラン溶液２当量に代えて、２－チアゾリルジンクブロミドの０．５Ｍテトラヒドロフラン溶液６当量を用いた以外は実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－アセトアミド－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートから表題の化合物を１９ｍｇ得た。
（ｃ）Ｎ－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）アセトアミド
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－アセトアミド－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１９ｍｇから表題の化合物を８．３ｍｇ得た。
【０１６２】
（実施例３５）
Ｎ－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）アセトアミド
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－アセトアミド－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例５で得られたＮ－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）アセトアミド２５０ｍｇから表題の化合物を３３ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－アセトアミド－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
２－チアゾリルジンクブロミドの０．５Ｍテトラヒドロフラン溶液２当量に代えて、２－チアゾリルジンクブロミドの０．５Ｍテトラヒドロフラン溶液６当量を用いた以外は実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－アセトアミド－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートから表題の化合物を２１ｍｇ得た。
（ｃ）Ｎ－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）アセトアミド
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－アセトアミド－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２１ｍｇから表題の化合物を１４ｍｇ得た。
【０１６３】
（実施例３６）
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－クロロベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
参考例６で得られた７－ブロモ－４－クロロベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１００ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を１５０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－クロロベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１３０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１３０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３６（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１３０ｍｇから表題の化合物を８５ｍｇ得た。

【０１６４】

（実施例３７）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－クロロベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例６で得られた７－ブロモ－４－クロロベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１００ｍｇから表題の化合物を１３５ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－クロロベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１３０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として２００ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を９０ｍｇ得た。

【０１６５】

（実施例３８）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－クロロベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例６で得ら

れた７－ブロモ－４－クロロベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１００ｍｇから表題の化合物を１６０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－クロロベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１３０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１８０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１８０ｍｇから表題の化合物を９０ｍｇ得た。

【０１６６】

（実施例３９）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（メチルチオ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

参考例７で得られた７－ブロモ－５－（メチルチオ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１００ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を１５３ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（メチルチオ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１５０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として３００ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３９（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を５８ｍｇ得た。

【０１６７】

（実施例４０）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（メチルチオ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例７で得られた７－ブロモ－５－（メチルチオ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１００ｍｇから表題の化合物を１２０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例４０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（メチルチオ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１１０ｍｇから表題の化合物を１０６ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１０３ｍｇから表題の化合物を６５ｍｇ得た。

【０１６８】

（実施例４１）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（メチルチオ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例７で得られた７－ブロモ－５－（メチルチオ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１００ｍｇから表題の化合物を１００ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例４１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（メチルチオ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート８０ｍｇから表題の化合物を７０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート６５ｍｇから表題の化合物を４０ｍｇ得た。

【０１６９】

（実施例４２）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メチルスル

フィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（メチルスルフィニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
参考例８で得られた７－ブロモ－５－（メチルスルフィニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１５０ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を２００ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例４２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（メチルスルフィニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を粗生成物として２２０ｍｇ得た。
（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート９０ｍｇから表題の化合物を４５ｍｇ得た。

【０１７０】

（実施例４３）
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（メチルスルフィニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例８で得られた７－ブロモ－５－（メチルスルフィニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１５０ｍｇから表題の化合物を２００ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例４３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（メチルスルフィニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を２００ｍｇ得た。
（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート８０ｍｇから表題の化合物を４２ｍｇ得た。

【０１７１】
（実施例４４）
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（メチルスルフィニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート
ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例８で得られた７－ブロモ－５－（メチルスルフィニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１００ｍｇから表題の化合物を１００ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート
１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例４４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（メチルスルフィニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１６５ｍｇから表題の化合物を１５０ｍｇ得た。
（ｃ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート８０ｍｇから表題の化合物を３９ｍｇ得た。
【０１７２】
（実施例４５）
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
実施例４２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１２０ｍｇ及びｍＣＰＢＡ（１７４ｍｇ，４当量）をジクロロメタン（５０ｍＬ）に溶解し室温で１時間反応させた。ＴＬＣで生成物を確認した後、飽和重曹水を加えジクロロメタンで抽出した。有機層を蒸留水で洗浄し無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として１３０ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート８０ｍｇから表題の化合物を４０ｍｇ得た。
【０１７３】
（実施例４６）
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（メチルスル

ホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例４５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例４３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１１５ｍｇから表題の化合物を９０ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート８０ｍｇから表題の化合物を４９ｍｇ得た。

【０１７４】

（実施例４７）
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート
実施例４５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例４４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート８５ｍｇから表題の化合物を８０ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート８０ｍｇから表題の化合物を４８ｍｇ得た。

【０１７５】

（実施例４８）
Ｎ－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセトアミド－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート
ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例９で得られたＮ－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド３００ｍｇから表題の化合物を３６２ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセトアミド－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート
５当量の２－チアゾリルジンクブロミドの０．５Ｍテトラヒドロフラン溶液及び０．３当量の１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンパラジウム（ＩＩ）ジクロリド・ジクロロメタン錯体を用いた以外は実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例４８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセトアミド－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カル

ボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を８９ｍｇ得た。

（ｃ）Ｎ－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセトアミド－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート８８ｍｇから表題の化合物を４５ｍｇ得た。

【０１７６】

（実施例４９）

Ｎ－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセトアミド－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例９で得られたＮ－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド２００ｍｇから表題の化合物を１３６ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセトアミド－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

５当量の２－チアゾリルジンクブロミドの０．５Ｍテトラヒドロフラン溶液及び０．３当量の１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンパラジウム（ＩＩ）ジクロリド・ジクロロメタン錯体を用いた以外は実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例４９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセトアミド－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を１００ｍｇ得た。

（ｃ）Ｎ－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４９（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセトアミド－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を２７ｍｇ得た。

【０１７７】

（実施例５０）

Ｎ－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセトアミド－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

参考例９で得られたＮ－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド１２０ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を１０７ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセトアミド－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

２－チアゾリルジンクブロミドの０．５Ｍテトラヒドロフラン溶液２当量に代えて、２－チアゾリルジンクブロミドの０．５Ｍテトラヒドロフラン溶液６当量を用いた以外は実

施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例５０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセトアミド－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート６０ｍｇから表題の化合物を５４ｍｇ得た。

（ｃ）Ｎ－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）アセトアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例５０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセトアミド－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５４ｍｇから表題の化合物を１８ｍｇ得た。

【０１７８】

（実施例５１）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

７－ブロモ－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール（国際公開第２０１５／００５４２９号の参考例２２の化合物）１０１ｍｇを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、表題の化合物を１０９ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

３．５当量の２－チアゾリルジンクブロミドの０．５Ｍテトラヒドロフラン溶液及び０．３当量の１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンパラジウム（ＩＩ）ジクロリド・ジクロロメタン錯体を用いた以外は実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例５１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１３２ｍｇから表題の化合物を６５ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例５１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート６５ｍｇから表題の化合物を４３ｍｇ得た。

【０１７９】

（実施例５２）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、７－ブロモ－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１５０ｍｇから表題の化合物を１３４ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例５２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１３４ｍｇから表題の化合物を７７ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例５２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート７７ｍｇから表題の化合物を２６ｍｇ得た。

【０１８０】

（実施例５３）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、７－ブロモ－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１５０ｍｇから表題の化合物を１３９ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例５３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１３９ｍｇから表題の化合物を９５．４ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例５３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート９５．４ｍｇから表題の化合物を４９．８ｍｇ得た。

【０１８１】

（実施例５４）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

参考例１０で得られた７－ブロモ－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１５０ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を１９２ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製、条件：１００℃，２０分）を用いた

以外は実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例５４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１９２ｍｇから表題の化合物を７７ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例５４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート７４ｍｇから表題の化合物を４９ｍｇ得た。

【０１８２】

（実施例５５）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１０で得られた７－ブロモ－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１５０ｍｇから表題の化合物を１９５ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製、条件：１００℃，２０分）を用いた以外は実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例５５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１９５ｍｇから表題の化合物を１５８ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例５５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１５８ｍｇから表題の化合物を１１４ｍｇ得た。

【０１８３】

（実施例５６）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートとマイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製、条件：１２０℃，４０分）を用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１０で得られた７－ブロモ－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１５０ｍｇから表題の化合物を１９６ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメ

トキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製、条件：１００℃，８０分）、２－チアゾリルジンクブロミド（１．６２ｍＬ，４当量）を用いた以外は実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例５６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１９４ｍｇから表題の化合物を１３３ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例５６（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１３３ｍｇから表題の化合物を１０３ｍｇ得た。

【０１８４】

（実施例５７）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－スルファモイルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

参考例１１で得られた７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド５１ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を４５ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－スルファモイル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

６．０当量の２－チアゾリルジンクブロミドの０．５Ｍテトラヒドロフラン溶液及び０．４当量の１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンパラジウム（ＩＩ）ジクロリド・ジクロロメタン錯体を用いた以外は実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例５７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－スルファモイルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４５ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例５７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－スルファモイル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１１ｍｇから表題の化合物を４．８ｍｇ得た。

【０１８５】

（実施例５８）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－スルファモイルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１１で

得られた７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド２００ｍｇから表題の化合物を１７０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－スルファモイル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

９当量の２－チアゾリルジンクブロミドの０．５Ｍテトラヒドロフラン溶液及び０．６当量の１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンパラジウム（ＩＩ）ジクロリド・ジクロロメタン錯体を用いた以外は実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例５８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－スルファモイルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を３２ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例５８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－スルファモイル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３２ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。

【０１８６】

（実施例５９）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－スルファモイルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１１で得られた７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド２０２ｍｇから表題の化合物を５６ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－スルファモイル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

６当量の２－チアゾリルジンクブロミドの０．５Ｍテトラヒドロフラン溶液及び０．４当量の１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンパラジウム（ＩＩ）ジクロリド・ジクロロメタン錯体を用いた以外は実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例５９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－スルファモイルベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート５６ｍｇから表題の化合物を３０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－スルホンアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例５９（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－スルファモイル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を１０ｍｇ得た。

【０１８７】

（実施例６０）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

参考例１２で得られた７－ブロモ－５－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール５０ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を７０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例６０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート７０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１２５ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例６０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１２０ｍｇから表題の化合物を３０ｍｇ得た。

【０１８８】

（実施例６１）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１２で得られた７－ブロモ－５－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１７５ｍｇから表題の化合物を２３０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例６１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２２５ｍｇから表題の化合物を粗生成物として２４５ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例６１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２４５ｍｇから表題の化合物を１４０ｍｇ得た。

【０１８９】

（実施例６２）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－

カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１２で得られた７－ブロモ－５－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１００ｍｇから表題の化合物を１５０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例６２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１５０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１７３ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例６２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート４５０ｍｇから表題の化合物を２４０ｍｇ得た。

【０１９０】

（実施例６３）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－オール

実施例６０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１３０ｍｇをジクロロメタン（１０ｍＬ）に溶解し、－７８℃で１．０Ｍ三臭化ホウ素のジクロロメタン溶液（２．１ｍＬ，７．５当量）を加え、室温で１８時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、蒸留水を加え反応を停止した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を６５ｍｇ得た。

【０１９１】

（実施例６４）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－オール

実施例６３と同様の方法を用いて、実施例６１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１４０ｍｇから表題の化合物を６５ｍｇ得た。

【０１９２】

（実施例６５）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－オール

実施例６３と同様の方法を用いて、実施例６２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート３４０ｍｇから表題の化合物を４０ｍｇ得た。

【０１９３】

（実施例６６）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

参考例１３で得られた７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１３１ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を１３１ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例６６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４７ｍｇから表題の化合物を３９ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例６６（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３９ｍｇから表題の化合物を３３ｍｇ得た。

【０１９４】

（実施例６７）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１３で得られた７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１６４ｍｇから表題の化合物を１６８ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例６７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート８９ｍｇから表題の化合物を２９ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例６７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２９ｍｇから表題の化合物を２１ｍｇ得た。

【０１９５】

（実施例６８）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－イソプロポキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８

－カルボキシレート
実施例６０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３３２ｍｇをＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（３．３ｍＬ）に溶解し、ナトリウムｔｅｒｔ－ブトキシド（５０５ｍｇ，７当量）及び２－（ジメチルアミノ）エタン－１－チオール塩酸塩（３１９ｍｇ，３当量）を加えアルゴン雰囲気下マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製）を用いて１６０℃にて１５分攪拌した。反応液に１Ｍ塩酸を加え酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝１：２）で精製して、表題の化合物を１３４ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－イソプロポキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
トリフェニルホスフィン（１８ｍｇ，１．５当量）、ジエチル　アゾジカルボキシレートの２．２Ｍトルエン溶液（３２ｍＬ，１．５当量）、２－プロパノール（５．４μＬ，１．５当量）をトルエン（０．５ｍＬ）に溶解し、実施例６８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇを加えアルゴン雰囲気下室温で１７時間攪拌した。プレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を１７ｍｇ得た。
（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－イソプロポキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例６８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－イソプロポキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１７ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。
【０１９６】
（実施例６９）
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
２－プロパノールに代えて２－メトキシエタノール（４２μＬ，１１．５当量）、トリフェニルホスフィン（１４４ｍｇ，１１．５当量）、ジエチル　アゾジカルボキシレートの２．２Ｍトルエン溶液（２４４μＬ，１１．５当量）を用いた以外は実施例６８（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例６８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として９０ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例６９（ａ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート９０ｍｇから表題の化合物を６．４ｍｇ得た。
【０１９７】
（実施例７０）
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（オキセタン

－３－イルメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（オキセタン－３－イルメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
実施例６８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇ、３－（ヨードメチル）オキセタン（２０ｍｇ，２．１当量）及び水素化ナトリウム（６．１ｍｇ，３当量）をＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（０．５ｍＬ）－テトラヒドロフラン（０．５ｍＬ）の混合溶媒に溶解し、９０℃で１０時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を１９ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（オキセタン－３－イルメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例７０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（オキセタン－３－イルメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１２ｍｇから表題の化合物を６．０ｍｇ得た。
【０１９８】
（実施例７１）
２－（（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）メチル）プロパン－１，３－ジオール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例７０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（オキセタン－３－イルメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１２ｍｇから表題の化合物を４．０ｍｇ得た。
【０１９９】
（実施例７２）
５－（アリルオキシ）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（アリルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
３－（ヨードメチル）オキセタンに代えてシクロプロピルブロミドを用いた以外は実施例７０（ａ）と同様の方法を用いて、実施例６８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を７．４ｍｇ得た。
（ｂ）５－（アリルオキシ）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例７２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（アリルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート６．９ｍｇから表題の化合物を５．４ｍｇ得た。
【０２００】
（実施例７３）
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）アセトニトリル

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（シアノメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例６８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０ｍｇをＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（２３０μＬ）に溶解し、室温で炭酸カリウム（８ｍｇ，２．４当量）及びブロモアセトニトリル（４μＬ，２．４当量）を加え、一晩攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を５．４ｍｇ得た。

（ｂ）２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）アセトニトリル

実施例７３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（シアノメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート９ｍｇをクロロホルム（０．２ｍＬ）及びトリフルオロ酢酸（６３μＬ）に溶解し、室温で３時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣にジエチルエーテルを加え、析出した固体を濾取して、表題の化合物のトリフルオロ酢酸塩を３ｍｇ得た。

【０２０１】

（実施例７４）

２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）酢酸

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－（ｔｅｒｔ－ブトキシ）－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

ブロモアセトニトリルに代えてｔｅｒｔ－ブチル　２－ブロモアセテートを用いた以外は実施例７３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例６８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を９ｍｇ得た。

（ｂ）２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）酢酸

実施例７３（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例７４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－（ｔｅｒｔ－ブトキシ）－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート９ｍｇから表題の化合物のトリフルオロ酢酸塩を７ｍｇ得た。

【０２０２】

（実施例７５）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

参考例１４で得られた７－ブロモ－４－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール２００ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を３００ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例７５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２５０ｍｇから表題の化合物を３００ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例７５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を１５０ｍｇ得た。

【０２０３】

（実施例７６）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１４で得られた７－ブロモ－４－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール２００ｍｇから表題の化合物を２８９ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例７６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２８０ｍｇから表題の化合物を３００ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例７６（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を１７８ｍｇ得た。

【０２０４】

（実施例７７）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１４で得

られた７－ブロモ－４－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール２００ｍｇから表題の化合物を３２０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例７７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－メトキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２７９ｍｇから表題の化合物を１８０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例７７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１８０ｍｇから表題の化合物を４０ｍｇ得た。

【０２０５】

（実施例７８）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－オール

実施例７５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１００ｍｇをジクロロメタン（１０ｍＬ）に溶解し、－７８℃で１．０Ｍ三臭化ホウ素のジクロロメタン溶液（２．９ｍＬ，１０当量）を加え、室温で１６時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、蒸留水を加え反応を停止した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を４０ｍｇ得た。

【０２０６】

（実施例７９）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－オール

実施例７８と同様の方法を用いて、実施例７６（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１８９ｍｇから表題の化合物を２４ｍｇ得た。

【０２０７】

（実施例８０）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－オール

実施例７８と同様の方法を用いて、実施例７７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を２５ｍｇ得た。

【０２０８】

（実施例８１）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－シクロブトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８

－カルボキシレート
実施例７５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－メトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４００ｍｇをＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（４．０ｍＬ）に溶解し、ナトリウムｔｅｒｔ－ブトキシド（６０８ｍｇ，７当量）及び２－（ジメチルアミノ）エタン－１－チオール塩酸塩（３８４ｍｇ，３当量）を加えアルゴン雰囲気下マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製）を用いて１６０℃にて１５分攪拌した。反応液に１Ｍ塩酸を加え酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝１：２）で精製して、表題の化合物を２８０ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－シクロブトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
トリフェニルホスフィン（７４ｍｇ，６．０当量）、ジエチル　アゾジカルボキシレート（４４μＬ，６当量）、シクロブタノール（２２μＬ，６当量）及びトルエン（０．５ｍＬ）－テトラヒドロフラン（１．０ｍＬ）を用いた以外は実施例６８（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例８１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。
（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－シクロブトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例８１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－シクロブトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１１ｍｇから表題の化合物を８．９ｍｇ得た。
【０２０９】
（実施例８２）
２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）アセトニトリル
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（シアノメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
３－（ヨードメチル）オキセタンに代えてブロモアセトニトリルを用いた以外は実施例７０（ａ）と同様の方法を用いて、実施例８１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を２２ｍｇ得た。
（ｂ）２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）アセトニトリル
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例８２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（シアノメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２２ｍｇから表題の化合物を１７ｍｇ得た。
【０２１０】
（実施例８３）
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３－メトキシプ

ロパン－２－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（オキシラン－２－イルメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
３－（ヨードメチル）オキセタンに代えてオキセタン－３－イルトリフルオロメタンスルホネートを用い、室温で反応を行った以外は実施例７０（ａ）と同様の方法を用いて、実施例８１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を１７ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－ヒドロキシ－３－メトキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
実施例８３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（オキシラン－２－イルメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１７ｍｇをメタノール（０．５ｍＬ）に溶解し、４．１Ｍナトリウムメトキシドのメタノール溶液（１７μＬ２当量）を加えアルゴン雰囲気下３０分加熱還流した。反応液に炭酸水素ナトリウム水溶液を加え酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：２）で精製して、表題の化合物を１３ｍｇ得た。
（ｃ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３－メトキシプロパン－２－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例８３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－ヒドロキシ－３－メトキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１３ｍｇから表題の化合物を１０ｍｇ得た。
【０２１１】
（実施例８４）
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
３－（ヨードメチル）オキセタンに代えてテトラヒドロフラン－３－イルトリフルオロメタンスルホネートを用いて、室温で反応を行った以外は実施例７０（ａ）と同様の方法を用いて、実施例８１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を１０ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例８４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を５．５ｍｇ得た。
【０２１２】
（実施例８５）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４，７－ジ（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例８１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇをジクロロメタン（０．４７ｍＬ）に溶解し、ジイソプロピルエチルアミン（１２μＬ，１．５当量）、トリフルオロメタンスルホン酸無水物を順次加えアルゴン雰囲気下－３０℃で３０分攪拌した。その後０℃まで昇温し、１時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加えクロロホルムで抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を２４ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４，７－ジ（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例８５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２３ｍｇをトルエン（０．１４ｍＬ）に溶解し、２－チアゾリルジンクブロミドの０．５Ｍテトラヒドロフラン溶液（４０９μＬ，５当量）及び１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセンパラジウム（ＩＩ）ジクロリド・ジクロロメタン錯体（６．７ｍｇ，０．２当量）を加えアルゴン雰囲気下１００℃、マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製）にて２０分攪拌した。反応液に飽和重曹水を加えセライト濾過を行った。濾液を酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を９．０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４，７－ジ（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例８５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４，７－ジ（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート９．０ｍｇから表題の化合物を４．７ｍｇ得た。

【０２１３】

（実施例８６）

エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

（ａ）エチル　７－ブロモ－２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

参考例１５で得られたエチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１００ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を１４５ｍｇ得た。

（ｂ）エチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例８６（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．

１］オクタン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２４０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として３５０ｍｇ得た。

（ｃ）エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例８６（ｂ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート３５０ｍｇから表題の化合物を１０５ｍｇ得た。

【０２１４】

（実施例８７）

エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

（ａ）エチル　７－ブロモ－２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１５で得られたエチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を１４０ｍｇ得た。

（ｂ）エチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例８７（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１４０ｍｇから表題の化合物を２６ｍｇ得た。

（ｃ）エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例８７（ｂ）で得られたエチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２９５ｍｇから表題の化合物を１２０ｍｇ得た。

【０２１５】

（実施例８８）

エチル　２－（３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－７－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　７－（７－ブロモ－５－（エトキシカルボニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１５で得られたエチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を４４０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　７－（５－（エトキシカルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例８８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　７－（７－ブロモ－５－（エトキシカルボニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル

）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート４００ｍｇから表題の化合物を３００ｍｇ得た。

（ｃ）エチル　２－（３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－７－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例８８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　７－（５－（エトキシカルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を２００ｍｇ得た。

【０２１６】

（実施例８９）

エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

（ａ）エチル　７－ブロモ－２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１５で得られたエチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を３１０ｍｇ得た。

（ｂ）エチル　２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例８９（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート４００ｍｇから表題の化合物を粗生成物として２８０ｍｇ得た。

（ｃ）エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例８９（ｂ）で得られたエチル　２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート３６０ｍｇから表題の化合物を１３０ｍｇ得た。

【０２１７】

（実施例９０）

エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

（ａ）エチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例８６（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を１４０ｍｇ得た。

（ｂ）エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例９０（ａ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カ

ルボキシレート１４０ｍｇから表題の化合物を９０ｍｇ得た。

【０２１８】

（実施例９１）

エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

（ａ）エチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例８７（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を１６０ｍｇ得た。

（ｂ）エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例９１（ａ）で得られたエチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１６０ｍｇから表題の化合物を１１０ｍｇ得た。

【０２１９】

（実施例９２）

エチル　２－（３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－７－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　７－（５－（エトキシカルボニル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例１５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例８８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　７－（７－ブロモ－５－（エトキシカルボニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２１０ｍｇから表題の化合物を１７０ｍｇ得た。

（ｂ）エチル　２－（３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－７－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例９２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　７－（５－（エトキシカルボニル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３－オキサ－７，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２２０ｍｇから表題の化合物を１４４ｍｇ得た。

【０２２０】

（実施例９３）

エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

（ａ）エチル　２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例８９（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を１６０ｍｇ得た。

（ｂ）エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例９３（ａ）で得られたエチル　２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１６０ｍｇから表題の化合物を１００ｍｇ得た。

【０２２１】

（実施例９４）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド

（ａ）２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸

実施例８６（ｂ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２５０ｍｇをテトラヒドロフラン：メタノール：水＝３：６：１（２．０ｍＬ）に溶解し、１Ｍ水酸化ナトリウム水溶液（１ｍＬ，２当量）を加え、室温で７日間攪拌した。反応液に１Ｍ塩酸（１ｍＬ）を加えクロロホルム：メタノール＝１０：１で抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム～クロロホルム：メタノール＝１０：１）で精製して、表題の化合物を２２０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ジメチルカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例９４（ａ）で得られた２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸１３ｍｇをＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（０．５ｍＬ）に溶解し、４－（４，６－ジメトキシ－１，３，５－トリアジン－２－イル）－４－メチルモルホリニウムクロリド・ｎ水和物（含量８２．２％、１６ｍｇ，２当量）、ジメチルアミンの２Ｍメタノール溶液（２８μＬ，２当量）を加え、室温で１９時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、クロロホルム：メタノール＝１０：１）で精製して、表題の化合物を１０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例９４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ジメチルカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を７．４ｍｇ得た。

【０２２２】

（実施例９５）

（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（モルホリノ）メタノン

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（モルホリン－４－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

ジメチルアミンの２Ｍメタノール溶液に代えてモルホリン（９μＬ，２当量）を用いた以外は実施例９４（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例９４（ａ）で得られた２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸２４ｍｇから表題の化合物を２８ｍｇ得た。

（ｂ）（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チ

アゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（モルホリノ）メタノン
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例９５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル３－（５－（モルホリン－４－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２８ｍｇから表題の化合物を２０ｍｇ得た。
【０２２３】
（実施例９６）
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（ピペリジン－１－イル）メタノン
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ピペリジン－１－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
ジメチルアミンの２Ｍメタノール溶液に代えてピペリジン（１０μＬ，２当量）を用いた以外は実施例９４（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例９４（ａ）で得られた２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸２４ｍｇから表題の化合物を２７ｍｇ得た。
（ｂ）（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（ピペリジン－１－イル）メタノン
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例９６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル３－（５－（ピペリジン－１－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２８ｍｇから表題の化合物を１８ｍｇ得た。
【０２２４】
（実施例９７）
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（アゼチジン－１－イル）メタノン
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（アゼチジン－１－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
ジメチルアミンの２Ｍメタノール溶液に代えてアゼチジン・塩酸塩（１０μＬ，２当量）とジイソプロピルエチルアミン（１９μＬ，２当量）を用いた以外は実施例９４（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例９４（ａ）で得られた２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸２５ｍｇから表題の化合物を９．８ｍｇ得た。
（ｂ）（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（アゼチジン－１－イル）メタノン
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例９７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル３－（５－（アゼチジン－１－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート９．８ｍｇから表題の化合物を７．０ｍｇ得た。
【０２２５】
（実施例９８）
Ｎ－ベンジル－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ベンジルカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

ジメチルアミンの２Ｍメタノール溶液に代えてベンジルアミン（１２μＬ，２当量）を用いた以外は実施例９４（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例９４（ａ）で得られた２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸２５ｍｇから表題の化合物を粗生成物として３９ｍｇ得た。

（ｂ）Ｎ－ベンジル－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例９８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ベンジルカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３９ｍｇから表題の化合物を２４ｍｇ得た。

【０２２６】

（実施例９９）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－カルバモイル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

ジメチルアミンの２Ｍメタノール溶液に代えて２８％アンモニア水（０．１ｍＬ，３０当量）を用いた以外は実施例９４（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例９４（ａ）で得られた２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸２５ｍｇから表題の化合物を粗生成物として２８ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例９９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－カルバモイル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２８ｍｇから表題の化合物を１５ｍｇ得た。

【０２２７】

（実施例１００）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

２Ｍジメチルアミンのメタノール溶液に代えてメチルアミンの２Ｍテトラヒドロフラン溶液（５５μＬ，２当量）を用いた以外は実施例９４（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例９４（ａ）で得られた２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸２５ｍｇから表題の化合物を粗生成物として２９ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１００（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メチルカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボ

キシレート２９ｍｇから表題の化合物を１９ｍｇ得た。

【０２２８】

（実施例１０１）

Ｎ－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－Ｎ－メチルアセトアミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（Ｎ－メチルアセトアミド）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

３－（ヨードメチル）オキセタンに代えてメチルヨージドを用い、溶媒としてＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミドのみを用いた以外は実施例７０（ａ）と同様の方法を用いて、実施例５０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセトアミド－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を２２ｍｇ得た。

（ｂ）Ｎ－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－Ｎ－メチルアセトアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１０１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（Ｎ－メチルアセトアミド）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２２ｍｇから表題の化合物を１３ｍｇ得た。

【０２２９】

（実施例１０２）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例８６（ｂ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート４９８ｍｇをトルエン（１０ｍＬ）に溶解し、－７８℃で水素化ジイソブチルアルミニウムの１．０Ｍトルエン溶液（５．２ｍＬ，５当量）を加え３０分攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加えセライト濾過を行った。酢酸エチルで抽出した有機層を蒸留水で洗浄し無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して粗生成物を得た。

得られた粗生成物及びデス－マーチンペルヨージナン（８６４ｍｇ，２当量）をクロロホルム（１０ｍＬ）に溶解し、０℃で９０分攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和重曹水及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝６：４）で精製して、表題の化合物を３７２ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１５０ｍｇをテトラヒドロフラン（３．４ｍＬ）に溶解し、－７８℃でメチルマグネシウムブロミドの０．９２Ｍテトラヒドロフラン溶液（０．８ｍＬ，２当量）を加え、０℃で２時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサ

ン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝３：７）で精製して、表題の化合物を１４６ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１４６ｍｇ及びデス－マーチンペルヨージナン（２７４ｍｇ，２当量）をクロロホルム（３．２ｍＬ）に溶解し、０℃で１時間攪拌後、室温に昇温しさらに１時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和重曹水及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝５：５）で精製して、表題の化合物を１０９ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート７０ｍｇ、トリフルオロメチルトリメチルシラン（１３８μＬ，６当量）及び炭酸セシウム（２．６ｍｇ，０．１当量）をテトラヒドロフラン（３．２ｍＬ）に溶解し、０℃で２時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和重曹水を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物をテトラヒドロフラン（１．５ｍＬ）に溶解し、１．０Ｍテトラブチルアンモニウムフルオリドのテトラヒドロフラン溶液（３０８μＬ，２当量）を加え０℃で１時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝６：４）で精製して、表題の化合物を７６ｍｇ得た。

（ｅ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４１ｍｇ、メチルヨージド（２０μＬ，４当量）及び水素化ナトリウム（１５．９ｍｇ，４．４当量）をテトラヒドロフラン（７８０μＬ）に溶解し、室温で１０時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を２９ｍｇ得た。

（ｆ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１０２（ｅ）で得られたｔｅｒｔ－ブチ

ル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２９ｍｇから表題の化合物を１８ｍｇ得た。

【０２３０】

（実施例１０３）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メトキシ（メチル）カルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例８７（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート９１ｍｇ及びＮ，Ｏ－ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩（５９ｍｇ，３当量）をテトラヒドロフラン（９６５μＬ）に溶解し、０℃でイソプロピルマグネシウムクロリドの２．０Ｍテトラヒドロフラン溶液（５８０μＬ，６当量）を加え３０分攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝１：９）で精製して、表題の化合物を８２ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メトキシ（メチル）カルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６７ｍｇをテトラヒドロフラン（０．７ｍＬ）に溶解し、０℃でメチルマグネシウムブロミドの０．９２Ｍテトラヒドロフラン溶液（１．５ｍＬ，１０当量）を加え、室温で３０分攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：４）で生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として６１ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製を行わなかった以外は実施例１０２（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例１０３（ｂ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６１ｍｇから表題の化合物を粗生成物として７０ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製を行わなかった以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１０３（ｃ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３５ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１７ｍｇ得た。

（ｅ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１０３（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１７ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

【０２３１】

（実施例１０４）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４４ｍｇ、ジフルオロメチルトリメチルシラン（５４μＬ，４当量）及びフッ化セシウム（６３ｍｇ，４当量）をＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１．０ｍＬ）に溶解し、室温で２０時間攪拌した。飽和重曹水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（アミノシリカ、ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝１：４）で精製して、表題の化合物を２１ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１０４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート６．６ｍｇから表題の化合物を４．８ｍｇ得た。

【０２３２】

（実施例１０５）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１０４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を９．０ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１０５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート９．０ｍｇから表題の化合物を６．９ｍｇ得た。

【０２３３】
（実施例１０６）
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１０２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４１ｍｇから表題の化合物を１７ｍｇ得た。
【０２３４】
（実施例１０７）
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例８７（ｂ）で得られたエチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１５０ｍｇをジクロロメタン（３．８ｍＬ）に溶解し、－７８℃で水素化ジイソブチルアルミニウムの１．０Ｍトルエン溶液（１．５ｍＬ，４当量）を加え１時間攪拌した。飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、反応を停止し酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例１０７（ａ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート及びデス－マーチンペルヨージナン（３２２ｍｇ，２当量）をクロロホルム（３．８ｍＬ）に溶解し、室温で１時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和重曹水及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（ヘキサン：酢酸エチル＝１：３）で精製して、表題の化合物を１０８ｍｇ得た
（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例１０２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１０７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１０８ｍｇから表題の化合物を５５ｍｇ得た。
（ｄ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１０７（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２８ｍｇから表題の化合物を２１ｍｇ得た。
【０２３５】
（実施例１０８）
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チア

ゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１０２（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１７．２ｍｇから表題の化合物を９．０ｍｇ得た。
【０２３６】
（実施例１０９）
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１０３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４６ｍｇから表題の化合物を７．６ｍｇ得た。
【０２３７】
（実施例１１０）
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１０２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２５ｍｇから表題の化合物を１５ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１１０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１５ｍｇから表題の化合物を１０ｍｇ得た。
【０２３８】
（実施例１１１）
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１０７（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２８ｍｇから表題の化合物を２５ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１１１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２５ｍｇから表題の化合物を２１ｍｇ得た。
【０２３９】
（実施例１１２）
エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チ

アゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
（ａ）エチル　７－ブロモ－２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
参考例１６で得られたエチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート１５０ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を１９５ｍｇ得た。
（ｂ）エチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１１２（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート１９５ｍｇから表題の化合物を粗生成物として２５０ｍｇ得た。
（ｃ）エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１１２（ｂ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート２５０ｍｇから表題の化合物を１２５ｍｇ得た。
【０２４０】
（実施例１１３）
エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
（ａ）エチル　７－ブロモ－２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１６で得られたエチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート１５０ｍｇから表題の化合物を１６４ｍｇ得た。
（ｂ）エチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１１３（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート１６０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として２７０ｍｇ得た。
（ｃ）エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１１３（ｂ）で得られたエチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート２７０ｍｇから表題の化合物を９８ｍｇ得た。
【０２４１】
（実施例１１４）

エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
（ａ）エチル　７－ブロモ－２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１６で得られたエチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート１５０ｍｇから表題の化合物を１８６ｍｇ得た。
（ｂ）エチル　２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１１４（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート１８０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として３００ｍｇ得た。
（ｃ）エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１１４（ｂ）で得られたエチル　２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を１００ｍｇ得た。
【０２４２】
（実施例１１５）
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシサミド
（ａ）２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボン酸
実施例９４（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１１２（ｂ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート４８ｍｇから表題の化合物を４５ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ジメチルカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
実施例９４（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１１５（ａ）で得られた２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボン酸１３ｍｇから表題の化合物を１３ｍｇ得た。
（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシサミド
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１１５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ジメチルカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１３ｍｇから表題の化合物を１０ｍｇ得た。
【０２４３】
（実施例１１６）

（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（モルホリノ）メタノン
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（モルホリン－４－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
ジメチルアミンの２Ｍメタノール溶液に代えてモルホリン（６．４μＬ，２当量）を用いた以外は実施例９４（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１１５（ａ）で得られた２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボン酸１７ｍｇから表題の化合物を２０ｍｇ得た。
（ｂ）（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（モルホリノ）メタノン
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１１６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（モルホリン－４－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。

【０２４４】

（実施例１１７）
（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（ピペリジン－１－イル）メタノン
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ピペリジン－１－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
ジメチルアミンの２Ｍメタノール溶液に代えてピペリジン（６．６μＬ，２当量）を用いた以外は実施例９４（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１１５（ａ）で得られた２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボン酸１５ｍｇから表題の化合物を１８ｍｇ得た。
（ｂ）（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（ピペリジン－１－イル）メタノン
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１１７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ピペリジン－１－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１８ｍｇから表題の化合物を１４ｍｇ得た。

【０２４５】

（実施例１１８）
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（光学活性体）
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
実施例１０２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１１２（ｂ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート１６９ｍｇから表題の化合物を１３０ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－

ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（ラセミ体）

実施例１１８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３８ｍｇ、トリフルオロメチルトリメチルシラン（５１μＬ，４当量）及び１．０Ｍテトラブチルアンモニウムフルオリドのテトラヒドロフラン溶液（１７．２μＬ，０．２当量）をテトラヒドロフラン（８６０μＬ）に溶解し、０℃で２時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、２Ｍ塩酸／メタノールを加え室温で３０分攪拌した。反応液に飽和重曹水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を２１ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（光学活性体）

実施例１１８（ｂ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１５７ｍｇをギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９５：５～８０：２０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が短いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を７２ｍｇ得た。９６％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９０：１０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１１．７分

（ｄ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（光学活性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１１８（ｂ）で得られた光学活性体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート７２ｍｇから表題の化合物を４９ｍｇ得た。９５％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＤ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール：ジエチルアミン＝８０：２０：０．１，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１２．０分。

【０２４６】

（実施例１１９）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（光学活性体、実施例１１８の鏡像異性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（光学活性体、実施例１１８（ｃ）の鏡像異性体）

実施例１１８（ｂ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カル

ボキシレート１５７ｍｇをギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９５：５～８０：２０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が長いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を７０ｍｇ得た。９８％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９０：１０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１５．５分

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（光学活性体、実施例１１８の鏡像異性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１１９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（光学活性体、実施例１１８（ｃ）の鏡像異性体）７０ｍｇから表題の化合物を５０ｍｇ得た。９８％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール：ジエチルアミン＝８０：２０：０．１，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１３．８分。

【０２４７】

（実施例１２０）

１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（光学活性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１１３（ｂ）で得られたエチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート４４０ｍｇから表題の化合物を３２３ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（ラセミ体）

実施例１２０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１００ｍｇ、トリフルオロメチルトリメチルシラン（１４０μＬ，４当量）及びフッ化セシウム（３．６ｍｇ，０．１当量）をテトラヒドロフラン（２．３ｍＬ）に溶解し、０℃で３０分攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、２Ｍ塩酸／メタノールを加え室温で２時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝７：３）で精製して、表題の化合物を７０ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体）

実施例１２０（ｂ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール

－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１４５ｍｇをギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９５：５～８０：２０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が短いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を６３ｍｇ得た。９８％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長；２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９０：１０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：２３．１分

（ｄ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（光学活性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１２０（ｃ）で得られた光学活性体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４０ｍｇから表題の化合物を２８ｍｇ得た。９９％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール：ジエチルアミン＝７０：３０：０．１，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１９．０分。

【０２４８】

（実施例１２１）

１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（光学活性体、実施例１２０の鏡像異性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体、実施例１２０（ｃ）の鏡像異性体）

実施例１２０（ｂ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１４５ｍｇをギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９５：５～８０：２０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が長いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を６４ｍｇ得た。９８％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９０：１０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：２８．６分

（ｂ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（光学活性体、実施例１２０の鏡像異性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１２１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．

１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体、実施例１２０（ｃ）の鏡像異性体）４０ｍｇから表題の化合物を２７ｍｇ得た。９７％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール：ジエチルアミン＝７０：３０：０．１，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：２３．８分。

【０２４９】

（実施例１２２）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール（光学活性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体）

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１２０（ｃ）で得られた光学活性のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１９ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール（光学活性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１２２（ａ）で得られた光学活性のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１６ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。９９％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＤ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール：ジエチルアミン＝７０：３０：０．１，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：９．６分。

【０２５０】

（実施例１２３）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール（光学活性体、実施例１２２の鏡像異性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体、実施例１２２（ａ）の鏡像異性体）

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１２１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体、実施例１２０（ｃ）の鏡像異性体）１９ｍｇから表題の化合物を１７ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール（光学活性体、実施例１２２の鏡像異性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１２３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メト

キシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体、実施例１２２（ａ）の鏡像異性体）１７ｍｇから表題の化合物を１３ｍｇ得た。９８％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＤ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール：ジエチルアミン＝７０：３０：０．１，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１１．６分。

【０２５１】

（実施例１２４）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オール

実施例１１８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４１ｍｇをテトラヒドロフラン（９２４μＬ）に溶解し、－７８℃でメチルマグネシウムブロミドの０．９２Ｍテトラヒドロフラン溶液（０．２ｍＬ，２当量）を加え２時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して粗生成物を得た。得られた粗生成物に対して、実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、表題の化合物を２０ｍｇ得た。

【０２５２】

（実施例１２５）

１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミドに代えてテトラヒドロフランを用い、フッ化セシウムに代えてカリウムｔｅｒｔ－ブトキシドを用いた以外は実施例１０４（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１２０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として得た。

（ｂ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１２５（ａ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートから表題の化合物を１．４ｍｇ得た。

【０２５３】

（実施例１２６）

２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロアセチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１２５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロ－

１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４８ｍｇ及びデス－マーチンペルヨージナン（１２７ｍｇ，３当量）をジクロロメタン（１．０ｍＬ）に溶解し、０℃で１時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、飽和重曹水及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝４：６）で精製して、表題の化合物を３２ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１２６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロアセチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３２ｍｇをテトラヒドロフラン（７００μＬ）に溶解し、－７８℃でメチルマグネシウムブロミドの０．９８Ｍテトラヒドロフラン溶液（０．６８ｍＬ，１０当量）を加え、室温で１時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を２２ｍｇ得た。

（ｃ）２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１２６（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２５ｍｇから表題の化合物を２２ｍｇ得た。

【０２５４】

（実施例１２７）

１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（２－（ｔｅｒｔ－ブトキシ）－２－オキソエトキシ）－２，２－ジフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１２５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート９．６ｍｇ、テトラブチルアンモニウムクロリド（０．６ｍｇ，０．１当量）、３５％水酸化ナトリウム水溶液（７０μＬ）及びｔｅｒｔ－ブチル　ブロモアセテート（４．４μＬ，１．５当量）をジクロロメタン（７０μＬ）に溶解し、室温で１５時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を１１ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレー

ト
実施例１２７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（２－（ｔｅｒｔ－ブトキシ）－２－オキソエトキシ）－２，２－ジフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１０ｍｇをテトラヒドロフラン（１７０μＬ）に溶解し、０℃でメチルマグネシウムブロミドの０．９８Ｍテトラヒドロフラン溶液（１７３μＬ，１０当量）を加え、室温で２時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：２）で精製して、表題の化合物を８ｍｇ得た。
（ｃ）１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２－ジフルオロエトキシ）－２－メチルプロパン－２－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１２７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート８ｍｇから表題の化合物を５ｍｇ得た。
【０２５５】
（実施例１２８）
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
０．２当量のフッ化セシウムを用いた以外は実施例１０４（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１１８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４４ｍｇから表題の化合物を１５ｍｇで得た。
（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１２８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート７ｍｇから表題の化合物を３．４ｍｇ得た。
【０２５６】
（実施例１２９）
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロアセチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
実施例１２６（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１２８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４９ｍｇから表題の化合物を５９ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１２６（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１２９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロアセチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５８ｍｇから表題の化合物を４４ｍｇ得た。

（ｃ）２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１２９（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４３ｍｇから表題の化合物を２９ｍｇ得た。

【０２５７】

（実施例１３０）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１２５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート７．５ｍｇから表題の化合物を粗生成物として得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１３０（ａ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートから表題の化合物を２．９ｍｇ得た。

【０２５８】

（実施例１３１）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１２８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート７ｍｇから表題の化合物を５．２ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１３１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートから表題の化合物を３．９ｍｇ得た。

【０２５９】

（実施例１３２）

（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（ヒドロキシメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

参考例１７で得られた（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール１００ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を１００ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１３２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（ヒドロキシメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１２０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として６０ｍｇ得た。

（ｃ）（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１３２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート７８ｍｇから表題の化合物を３０ｍｇ得た。

【０２６０】

（実施例１３３）

（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（ヒドロキシメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１７で得られた（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール５０ｍｇから表題の化合物を５０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１３３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（ヒドロキシメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート９０ｍｇから表題の化合物を６０ｍｇ得た

。
（ｃ）（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１３３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６０ｍｇから表題の化合物を２０ｍｇ得た。
【０２６１】
（実施例１３４）
（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（ヒドロキシメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート
ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１７で得られた（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール８０ｍｇから表題の化合物を８０ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート
１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（ヒドロキシメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１１０ｍｇから表題の化合物を１００ｍｇ得た。
（ｃ）（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）メタノール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１３４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を４５ｍｇ得た。
【０２６２】
（実施例１３５）
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１８で得られた１－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール４００ｍｇから表題の化合物を５０４ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－

ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１３５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を１４４ｍｇ得た。

（ｃ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１３５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１９０ｍｇから表題の化合物を５０ｍｇ得た。

【０２６３】

（実施例１３６）

１－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１８で得られた１－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール４００ｍｇから表題の化合物を６０８ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１３６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を２４４ｍｇ得た。

（ｃ）１－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１３６（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１３０ｍｇから表題の化合物を６０ｍｇ得た。

【０２６４】

（実施例１３７）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（ラセミ体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

参考例１８で得られた１－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール３００ｍｇとｔｅｒｔ－ブチ

ル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、表題の化合物を３５９ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（ラセミ体）

実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１３７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３５８ｍｇから表題の化合物を３２９ｍｇ得た。

（ｃ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（ラセミ体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１３７（ｂ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３２９ｍｇから表題の化合物を２２０ｍｇ得た。

【０２６５】

（実施例１３８）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（光学活性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（光学活性体）

実施例１３７（ｂ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３０ｍｇをギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９０：１０～８０：２０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が短いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を１４ｍｇ得た。９８％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９０：１０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１８．５分

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（光学活性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１３８（ａ）で得られた光学活性のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１４ｍｇから表題の化合物を８．１ｍｇ得た。

【０２６６】

（実施例１３９）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（光学活性体、実施例１３８の鏡像異性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（光学活性体、実施例１３８（ａ）の鏡像異性体）

実施例１３７（ｂ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３０ｍｇをギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９０：１０～８０：２０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が長いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を１３ｍｇ得た。９９．７％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９０：１０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：２０．０分

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（光学活性体、実施例１３８の鏡像異性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１３９（ａ）で得られた光学活性のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１３ｍｇから表題の化合物を７．８ｍｇ得た。

【０２６７】

（実施例１４０）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１３７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を１８ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１４０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１８ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。

【０２６８】

（実施例１４１）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエチルアセテート

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－アセトキシ－２，２，２－トリフルオロエチ

ル）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１３７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１６５ｍｇをジクロロメタン（２０ｍＬ）に溶解し、０℃で４－ジメチルアミノピリジン（８ｍｇ，０．２当量）、トリエチルアミン（０．１ｍＬ，３当量）及び塩化アセチル（０．１ｍＬ，４当量）を加え、室温で１時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、０℃で飽和重曹水を加え反応を停止し、ジクロロメタンで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として１６０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－アセトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１４１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－アセトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１６０ｍｇから表題の化合物を８０ｍｇ得た。

（ｃ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエチルアセテート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１４１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－アセトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート７０ｍｇから表題の化合物を５０ｍｇ得た。

【０２６９】

（実施例１４２）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール（光学活性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（ラセミ体）

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１３７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート８１ｍｇから表題の化合物を４６ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（光学活性体）

実施例１４２（ａ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１９４ｍｇをギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９５：５～８０：２０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が短いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を７９ｍｇ得た。９８％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルア

ルコール＝９０：１０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ、温度２５℃），保持時間：７．８分

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール（光学活性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１４２（ｂ）で得られた光学活性体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート７９ｍｇから表題の化合物を６４ｍｇ得た。９８％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＤ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール：ジエチルアミン＝７０：３０：０．１，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１３分。

【０２７０】

（実施例１４３）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール（光学活性体、実施例１４２の鏡像異性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（光学活性体、実施例１４２（ｂ）の鏡像異性体）

実施例１４２（ａ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１９４ｍｇをギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９５：５～８０：２０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が長いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を８０ｍｇ得た。９９．５％。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９０：１０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：８．９分

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール（光学活性体、実施例１４２の鏡像異性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１４３（ａ）で得られた光学活性体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート８０ｍｇから表題の化合物を６６ｍｇ得た。９９．４％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＤ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール：ジエチルアミン＝７０：３０：０．１，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１６分。

【０２７１】

（実施例１４４）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール

－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
プレパラティブＴＬＣで精製を行っていないこと以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１３５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として５１ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１４４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５１ｍｇから表題の化合物を３８ｍｇ得た。

【０２７２】

（実施例１４５）
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート
プレパラティブＴＬＣで精製を行っていないこと以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１３６（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート５０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として５１ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１４５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート５１ｍｇから表題の化合物を３０ｍｇ得た。

【０２７３】

（実施例１４６）
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
メチルヨージドに代えてトリフルオロメタンスルホン酸２，２，２－トリフルオロエチルを用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１３７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジ

アザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４１ｍｇから表題の化合物を２３ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１４６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２３ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

【０２７４】

（実施例１４７）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

メチルヨージドに代えて２－ブロモエチルメチルエーテルを用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１３７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３６ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１４７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１６ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

【０２７５】

（実施例１４８）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

メチルヨージドに代えてエチルヨージドを用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１３７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を１９ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１４８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２

．１］オクタン－８－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。

【０２７６】

（実施例１４９）

２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）エタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１３７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート６０ｍｇ、（２－ブロモエトキシ）－ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシラン（９３０μＬ，３６当量）及び水素化ナトリウム（５７．０ｍｇ，１９．８当量）をテトラヒドロフラン（１．２ｍＬ）に溶解し、室温で１０時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として１１６ｍｇ得た。

（ｂ）２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）エタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１４９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートの粗生成物１１６ｍｇから表題の化合物を１４ｍｇ得た。

【０２７７】

（実施例１５０）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

メチルヨージドに代えてエチルヨージドを用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１３５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４０ｍｇから表題の化合物を３５ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１５０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３５ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。

【０２７８】

（実施例１５１）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエト

キシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
メチルヨージドに代えてトリフルオロメタンスルホン酸２，２，２－トリフルオロエチルを用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１３５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５０ｍｇから表題の化合物を２３ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１５１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２３ｍｇから表題の化合物を７．５ｍｇ得た。
【０２７９】
（実施例１５２）
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
メチルヨージドに代えてブロモアセトニトリルを用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１３５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６０ｍｇから表題の化合物を４２ｍｇ得た。
（ｂ）２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１５２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２１ｍｇから表題の化合物を９．３ｍｇ得た。
【０２８０】
（実施例１５３）
２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
メチルヨージドに代えてブロモアセトニトリルを用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１３７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チア

ゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート６１ｍｇから表題の化合物を４６ｍｇ得た。

（ｂ）２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１５３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２３ｍｇから表題の化合物を１３ｍｇ得た。

【０２８１】

（実施例１５４）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

メチルヨージドに代えて２－ブロモエチルメチルエーテルを用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１３５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４０ｍｇから表題の化合物を３０ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１５４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を１８ｍｇ得た。

【０２８２】

（実施例１５５）

１－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）プロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

メチルヨージドに代えてブロモアセトニトリルを用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１３７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１８４ｍｇから表題の化合物を２３０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－オキソプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１５５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オ

キサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２３０ｍｇをジエチルエーテル（２．１ｍＬ）に溶解し、０℃でメチルマグネシウムブロミドの０．９２Ｍテトラヒドロフラン溶液（２．９ｍＬ，６．５当量）を加え、０℃で５時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、１Ｍ塩酸を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出した有機層を飽和重曹水で分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を６８ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１５５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－オキソプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２７ｍｇ、水素化ホウ素ナトリウム（３．６ｍｇ，２当量）をエタノール（４８０μＬ）に溶解し、０℃で２時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として得た。

（ｄ）１－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）プロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１５５（ｃ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートから表題の化合物を１５ｍｇ得た。

【０２８３】

（実施例１５６）

１－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例１３６（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１３ｍｇ及びデス－マーチンペルヨージナン（４２ｍｇ，４当量）をクロロホルム（２５０μＬ）に溶解し、室温で１時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和重曹水及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して粗生成物を１３ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１５６（ａ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１３ｍｇから表題の化合物を４

．７ｍｇ得た。
【０２８４】
（実施例１５７）
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
実施例１５６（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１３７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１００ｍｇから表題の粗生成物を１１０ｍｇ得た。
（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１５７（ａ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を３．７ｍｇ得た。
【０２８５】
（実施例１５８）
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例１５６（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１３５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート８４ｍｇから表題の粗生成物を８９ｍｇ得た。
（ｂ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１５８（ａ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。
【０２８６】
（実施例１５９）
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル

）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１５７（ａ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５３ｍｇをテトラヒドロフラン（３．４ｍＬ）に溶解し、０℃で塩化ランタン（ＩＩＩ）ビス塩化リチウム錯体の０．６Ｍテトラヒドロフラン溶液（０．５９ｍＬ，３当量）及びメチルマグネシウムブロミドの０．９２Ｍテトラヒドロフラン溶液（０．３２ｍＬ，３当量）を加え、０℃で３時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を３８ｍｇ得た。

（ｂ）２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１５９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３８ｍｇから表題の化合物を２８ｍｇ得た。

【０２８７】

（実施例１６０）

２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１５９（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１５８（ａ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５９ｍｇから表題の化合物を５４ｍｇ得た。

（ｂ）２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１６０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５３ｍｇから表題の化合物を５ｍｇ得た。

【０２８８】

（実施例１６１）

２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例１５９（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１５６（ａ）で得られた粗生成物の

ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート７２ｍｇから表題の化合物を５６ｍｇ得た。

（ｂ）２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１６１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２６ｍｇから表題の化合物を１９ｍｇ得た。

【０２８９】

（実施例１６２）

２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１６１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を１９ｍｇ得た。

（ｂ）２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１６２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１９ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。

【０２９０】

（実施例１６３）

エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

（ａ）エチル　７－ブロモ－２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

参考例１９で得られたエチル　７－ブロモ－２－メルカプト－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１５０ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を２００ｍｇ得た。

（ｂ）エチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０

）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１６３（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を粗生成物として２５０ｍｇ得た。

（ｃ）エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１（ｃ）と同様の方法用いて、実施例１６３（ｂ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２５０ｍｇから表題の化合物を１５０ｍｇ得た。

【０２９１】

（実施例１６４）

エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

（ａ）エチル　７－ブロモ－２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１９で得られたエチル　７－ブロモ－２－メルカプト－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１５０ｍｇから表題の化合物を２００ｍｇ得た。

（ｂ）エチル　２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１６４（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を粗生成物として３５０ｍｇ得た。

（ｃ）エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１６４（ｂ）で得られたエチル　２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート３５０ｍｇから表題の化合物を１５０ｍｇ得た。

【０２９２】

（実施例１６５）

エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

（ａ）エチル　７－ブロモ－２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６

－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例１９で得られたエチル　７－ブロモ－２－メルカプト－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１５０ｍｇから表題の化合物を２００ｍｇ得た。

（ｂ）エチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１６５（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を２５０ｍｇ得た。

（ｃ）エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１６５（ｂ）で得られたエチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を７０ｍｇ得た。

【０２９３】

（実施例１６６）

２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

４当量の塩化ランタン（ＩＩＩ）ビス塩化リチウム錯体の０．６Ｍテトラヒドロフラン溶液及び８当量のメチルマグネシウムブロミドの０．９２Ｍテトラヒドロフラン溶液を用いた以外は実施例１５９（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１６４（ｂ）で得られたエチル２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２６ｍｇから表題の化合物を６．１ｍｇ得た。

（ｂ）２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１６６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート６．１ｍｇから表題の化合物を３．７ｍｇ得た。

【０２９４】

（実施例１６７）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メトキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１６３（ｂ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１６ｍｇをトルエン（２９０μＬ）に溶解し、－７８℃で水素化ジイソブチルアルミニウムの１．０Ｍトルエン溶液（１２３μＬ，４．２当量）を加え２時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加えセライト濾過を行った。酢酸エチルで抽出した有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を１３ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メトキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１６７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３５ｍｇから表題の化合物を２３ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（メトキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１６７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（メトキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２３ｍｇから表題の化合物を１８ｍｇ得た。

【０２９５】

（実施例１６８）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（モルホリノメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１６７（ａ）と同様の方法を用いて、実施例８６（ｂ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２６７ｍｇから表題の化合物を１４１ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（モルホリノメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１６８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇをジクロロメタン（０．５ｍＬ）に溶解し、ジイソプロピルエチルアミン（２３．６μＬ，３当量）、メタンスルホニルクロリド（１０．５μＬ，３当量）を順次加え、室温で１時間攪拌した。反応液を濃縮後、得られた残渣をＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（０．５ｍＬ）に溶解し、モルホリン（１９．７μＬ，５当量）を加え、室温で１６時間撹拌した。反応液に飽和重曹水を加え酢酸エチルで抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、クロロホルム：メタノール＝１０：１）で精製して、表題の化合物を２３ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（モルホリノメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１６８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（モルホリノメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２３ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。

【０２９６】

（実施例１６９）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルメタンアミン

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（（ジメチルアミノ）メチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

モルホリンに代えてジメチルアミンの２Ｍメタノール溶液（０．４６ｍＬ，２０当量）を用いた以外は実施例１６８（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１６８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を１０ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチルメタンアミン

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１６９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（（ジメチルアミノ）メチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を７．５ｍｇ得た。

【０２９７】

（実施例１７０）

（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）メタノール

実施例１６３（ｃ）で得られたエチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート３０ｍｇをテトラヒドロフラン（３３０μＬ）に溶解し、室温で水素化リチウムアルミニウム（１０ｍｇ，４当量）を加え１０分撹拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、クロロホルム：メタノール：アンモニア水＝３：１：０．１）で生成物を確認した後、硫酸ナトリウム１０水和物、ヘキサン、セライト及び硫酸マグネシウムを加えセライト濾過を行った。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、クロロホルム：メタノール：アンモニア水＝３：１：０．１）で精製して、表題の化合物を１９ｍｇ得た。

【０２９８】

（実施例１７１）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１６３（ｂ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を１７２ｍｇ

得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１７１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２１５ｍｇから表題の化合物を１６５ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１７１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０２ｍｇから表題の化合物を８９ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１７１（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート８９ｍｇをテトラヒドロフラン（１．１ｍＬ）に溶解し、－７８℃で塩化ランタン（ＩＩＩ）ビス塩化リチウム錯体の０．６Ｍテトラヒドロフラン溶液（２．７ｍＬ，８当量）及びメチルマグネシウムブロミドの０．９２Ｍテトラヒドロフラン溶液（１．５ｍＬ，８当量）を加え、－７８℃で３０分攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として９１ｍｇ得た。

（ｅ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

２５当量のメチルヨージド及び２０当量の水素化ナトリウムを用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１７１（ｄ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１５ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。

（ｆ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１７１（ｅ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１６ｍｇから表題の化合物を１０ｍｇ得た。

【０２９９】

（実施例１７２）

２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１７１（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例８６（ｂ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート５２ｍｇから表題の化合物を４１ｍｇ得た。

（ｂ）２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１７２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１１ｍｇから表題の化合物を８．９ｍｇ得た。

【０３００】

（実施例１７３）

２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１７１（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例８７（ｂ）で得られたエチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート５０ｍｇから表題の化合物を４３ｍｇ得た。

（ｂ）２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１７３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４３ｍｇから表題の化合物を２６ｍｇ得た。

【０３０１】

（実施例１７４）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１７３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２９ｍｇから表題の化合物を２９ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１７４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２９ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。

【０３０２】

（実施例１７５）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１７２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２３ｍｇから表題の化合物を２２ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１７５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２３ｍｇから表題の化合物を１５ｍｇ得た。

【０３０３】

（実施例１７６）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１６５（ｂ）で得られたエチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２２８ｍｇから表題の化合物を１６６ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製を行っていないこと以外は実施例１０２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１７６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１６６ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１６７ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１７６（ｂ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１１２ｍｇから表題の化合物を１００ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

－７８℃から０℃に昇温し３０分攪拌した以外は実施例１７１（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例１７６（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チ

アゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート７４ｍｇから表題の化合物を粗生成物として７７ｍｇ得た。

（ｅ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

プレパラティブＴＬＣで精製を行っていないこと以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１７６（ｄ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２９ｍｇから表題の化合物を２９ｍｇ得た。

（ｆ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１７６（ｅ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２９ｍｇから表題の化合物を１４ｍｇ得た。

【０３０４】

（実施例１７７）

２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１７１（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１６ｍｇから表題の化合物を９．２ｍｇ得た。

【０３０５】

（実施例１７８）

２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１７６（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５０ｍｇから表題の化合物を２５ｍｇ得た。

【０３０６】

（実施例１７９）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１７１（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３１ｍｇから表題の化合物を１８ｍｇ得た。

【０３０７】

（実施例１８０）

１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１７６（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２５ｍｇから表題の化合物を１７ｍｇ得た。

【０３０８】

（実施例１８１）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１７１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１２ｍｇから表題の化合物を７．０ｍｇ得た。

【０３０９】

（実施例１８２）

１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１７６（ｂ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２８ｍｇから表題の化合物を１４ｍｇ得た。

【０３１０】

（実施例１８３）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１７１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０ｍｇ、トリフェニルホスフィン（１０．５ｍｇ，２当量）及び（ブロモジフルオロメチル）トリメチルシラン（６．２μＬ，２当量）をＤＭＰＵ（１００μＬ）に溶解し、室温で１８時間撹拌した。１Ｍ水酸化カリウム水溶液（０．４ｍＬ）を加え、室温で１時間撹拌した後、酢酸エチルを加え抽出した有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（アミノシリカ、展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を６．４ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１８３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８

－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート６．４ｍｇから表題の化合物を２．９ｍｇ得た。

【０３１１】

（実施例１８４）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

プレパラティブＴＬＣで精製を行っていないこと以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１７１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１５ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１６ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１８４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１６ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。

【０３１２】

（実施例１８５）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

プレパラティブＴＬＣで精製を行っていないこと以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１７６（ｂ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２１ｍｇから表題の化合物を粗生成物として２２ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１８５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２２ｍｇから表題の化合物を１４ｍｇ得た。

【０３１３】

（実施例１８６）

エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

（ａ）エチル　７－ブロモ－２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

参考例２０で得られたエチル　７－ブロモ－２－メルカプト－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１００ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を１２９ｍｇ得た。

（ｂ）エチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１８６（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート３７８ｍｇから表題の化合物を粗生成物として６００ｍｇ得た。

（ｃ）エチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１８６（ｂ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート４００ｍｇから表題の化合物を１１５ｍｇ得た。

【０３１４】

（実施例１８７）

エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

（ａ）エチル　７－ブロモ－２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２０で得られたエチル　７－ブロモ－２－メルカプト－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１２０ｍｇから表題の化合物を１１０ｍｇ得た。

（ｂ）エチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１８７（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１１０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１７０ｍｇ得た。

（ｃ）エチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１８７（ｂ）で得られたエチル　２－（

６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１７０ｍｇから表題の化合物を７５ｍｇ得た。

【０３１５】

（実施例１８８）

エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

（ａ）エチル　７－ブロモ－２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２０で得られたエチル　７－ブロモ－２－メルカプト－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１２０ｍｇから表題の化合物を１７０ｍｇ得た。

（ｂ）エチル　２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

１，４－ジオキサンに代えてトルエンを用い、ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（ＩＩ）ジクロリドに代えてテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）を用いた以外は実施例２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１８８（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１７０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１８０ｍｇ得た。

（ｃ）エチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１８８（ｂ）で得られたエチル　２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１８０ｍｇから表題の化合物を１１０ｍｇ得た。

【０３１６】

（実施例１８９）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸

実施例１８６（ｃ）で得られたエチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート５４ｍｇをテトラヒドロフラン（３．２ｍＬ）、エタノール（３．２ｍＬ）及び蒸留水（３．２ｍＬ）に溶解し、水酸化リチウム（９ｍｇ，２当量）を加え、８０℃で４時間加熱した。ＴＬＣで生成物を確認した後、反応液を減圧濃縮し得られた残渣に０℃でクエン酸を加え、ｐＨを２に調節した。生じた固体を濾取し減圧乾燥を行い表題の化合物を４０ｍｇ得た。

【０３１７】

（実施例１９０）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール

－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸

実施例１８９と同様の方法を用いて、実施例１８７（ｃ）で得られたエチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート３９ｍｇから表題の化合物を２５ｍｇ得た。

【０３１８】

（実施例１９１）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸

実施例１８９と同様の方法を用いて、実施例１８８（ｃ）で得られたエチル　２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート６０ｍｇから表題の化合物を４０ｍｇ得た。

【０３１９】

（実施例１９２）

（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（アゼチジン－１－イル）メタノン

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（アゼチジン－１－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

ジメチルアミンの２Ｍメタノール溶液に代えてアゼチジン塩酸塩（２１ｍｇ，４当量）、４－（４，６－ジメトキシ－１，３，５－トリアジン－２－イル）－４－メチルモルホリニウムクロリド・ｎ水和物（含量８２．２％，７４．７ｍｇ，４当量）を用いた以外は実施例９４（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１８９で得られた２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸３０ｍｇから表題の化合物を２６ｍｇ得た。

（ｂ）（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（アゼチジン－１－イル）メタノン

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１９２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（アゼチジン－１－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２６ｍｇから表題の化合物を２１ｍｇ得た。

【０３２０】

（実施例１９３）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（（２－ヒドロキシエチル）（メチル）カルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

ジメチルアミンの２Ｍメタノール溶液に代えて２－（メチルアミノ）エタン－１－オール（９．６μＬ，４当量）、４－（４，６－ジメトキシ－１，３，５－トリアジン－２－イル）－４－メチルモルホリニウムクロリド・ｎ水和物（含量８２．２％，４０ｍｇ，４当量）を用いた以外は実施例９４（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１８９で得られた

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸１６ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキサミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１９３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（（２－ヒドロキシエチル）（メチル）カルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１６ｍｇから表題の化合物を１３ｍｇ得た。

【０３２１】

（実施例１９４）

（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（３－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）アゼチジン－１－イル）メタノン

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（３－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）アゼチジン－１－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

ジメチルアミンの２Ｍメタノール溶液に代えて３－（トリフルオロメチル）アゼチジン－３－オール塩酸塩（３８ｍｇ，４当量）、４－（４，６－ジメトキシ－１，３，５－トリアジン－２－イル）－４－メチルモルホリニウムクロリド・ｎ水和物（含量８２．２％，７１ｍｇ，４当量）を用いた以外は実施例９４（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１８９で得られた２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボン酸２９ｍｇから不純物を含む表題の化合物を３９ｍｇ得た。

（ｂ）（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）（３－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）アゼチジン－１－イル）メタノン

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１９４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（３－ヒドロキシ－３－（トリフルオロメチル）アゼチジン－１－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３９ｍｇから表題の化合物を１５ｍｇ得た。

【０３２２】

（実施例１９５）

２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１７１（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例１８６（ｂ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート５０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として４９ｍｇ得た。

（ｂ）２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－

５－イル）プロパン－２－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１９５（ａ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４９ｍｇから表題の化合物を３０ｍｇ得た。
【０３２３】
（実施例１９６）
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製した以外は実施例１７１（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例１８７（ｂ）で得られたエチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート４９ｍｇから表題の化合物を２６ｍｇ得た。
（ｂ）２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１９６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２６ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。
【０３２４】
（実施例１９７）
２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート
粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製した以外は実施例１７１（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例１８８（ｂ）で得られたエチル　２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート８６ｍｇから表題の化合物を５９ｍｇ得た。
（ｂ）２－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１９７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２６ｍｇから表題の化合物を１５ｍｇ得た。
【０３２５】
（実施例１９８）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１９５（ａ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を１８ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１９８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１８ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

【０３２６】

（実施例１９９）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１９６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート７１ｍｇから表題の化合物を３８ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１９９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３８ｍｇから表題の化合物を２０ｍｇ得た。

【０３２７】

（実施例２００）

２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１９７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イ

ル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート３２ｍｇから表題の化合物を２３ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２００（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート２３ｍｇから表題の化合物を１３ｍｇ得た。

【０３２８】

（実施例２０１）

（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）メタノール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１８６（ｂ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２１ｍｇをトルエン（３７０μＬ）に溶解し、－７８℃で水素化ジイソブチルアルミニウムの１．０Ｍトルエン溶液（０．１９ｍＬ，５当量）を加え１時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加えセライト濾過を行った。酢酸エチルで抽出した有機層を蒸留水で洗浄し無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として２０ｍｇ得た。

（ｂ）（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）メタノール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２０１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１５ｍｇから表題の化合物を６．３ｍｇ得た。

【０３２９】

（実施例２０２）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２０１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇ及びデス－マーチンペルヨージナン（３１ｍｇ，２当量）をクロロホルム（３７０μＬ）に溶解し、０℃で３時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和重曹水及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液

を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として１９ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製を行っていないこと以外は実施例１０２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２０２（ａ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１９ｍｇから表題の化合物を粗生成物として２０ｍｇ得た。
（ｃ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２０２（ｂ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。
【０３３０】
（実施例２０３）
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例１０２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１８７（ｂ）で得られたエチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１１１ｍｇから表題の化合物を５６ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例１０２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２０３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５４ｍｇから表題の化合物を３５ｍｇ得た。
（ｃ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２０３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２６ｍｇから表題の化合物を１８ｍｇ得た。
【０３３１】
（実施例２０４）
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

メチルマグネシウムブロミドの０．９２Ｍテトラヒドロフラン溶液に代えてエチルマグネシウムブロミドの０．９６Ｍテトラヒドロフラン溶液（３９７μＬ，１０当量）を用いた以外は実施例１０２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２０２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を１０ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２０４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を８．４ｍｇ得た。

【０３３２】

（実施例２０５）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２－メチルプロパン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシ－２－メチルプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

メチルマグネシウムブロミドの０．９２Ｍテトラヒドロフラン溶液に代えてイソプロピルマグネシウムブロミドの０．７４Ｍテトラヒドロフラン溶液（０．３１ｍＬ，５．９当量）を用いた以外は実施例１０２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２０２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を３．６ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２－メチルプロパン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２０５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシ－２－メチルプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３．６ｍｇから表題の化合物を２．０ｍｇ得た。

【０３３３】

（実施例２０６）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１８３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２０２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－

ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１５ｍｇから表題の化合物を１５ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２０６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１５ｍｇから表題の化合物を６．９ｍｇ得た。

【０３３４】

（実施例２０７）

１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１８３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２０３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４０ｍｇから表題の化合物を４０ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２０７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４０ｍｇから表題の化合物を２４ｍｇ得た。

【０３３５】

（実施例２０８）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２０７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２７ｍｇから表題の化合物を２０ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２０８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－

イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１９ｍｇから表題の化合物を１５ｍｇ得た。

【０３３６】

（実施例２０９）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２０６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２９ｍｇから表題の化合物を２５ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２０９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２４ｍｇから表題の化合物を１８ｍｇ得た。

【０３３７】

（実施例２１０）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２０２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５７ｍｇから表題の化合物を４５ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２１０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４５ｍｇから表題の化合物を３６ｍｇ得た。

【０３３８】

（実施例２１１）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－

イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

プレパラティブＴＬＣで精製を行っていないこと以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２０３（ｂ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として３１ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２１１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３１ｍｇから表題の化合物を１８ｍｇ得た。

【０３３９】

（実施例２１２）

１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２０３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１０８ｍｇから表題の化合物を１００ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２１２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１９ｍｇから表題の化合物を１０ｍｇ得た。

【０３４０】

（実施例２１３）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２０２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート８８ｍｇから表題の化合物を７０ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２１３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１５ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。

【０３４１】

（実施例２１４）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２１２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２３ｍｇ、トリフルオロメチルトリメチルシラン（４０μＬ，６当量）及びフッ化セシウム（１．４ｍｇ，０．２当量）をテトラヒドロフラン（４４０μＬ）に溶解し、０℃で６時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、２Ｍ塩酸／イソプロピルアルコールを加え室温で３０分攪拌した。反応液に１Ｍ水酸化ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を１４ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２１４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１４ｍｇから表題の化合物を７．２ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２１４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート７．２ｍｇから表題の化合物を５．１ｍｇ得た。

【０３４２】

（実施例２１５）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

４当量のトリフルオロメチルトリメチルシランを用いた以外は実施例１０２（ｄ）と同

様の方法を用いて、実施例２１３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３８ｍｇから表題の化合物を３３ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２１５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１５ｍｇから表題の化合物を１５ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２１５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１５ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。

【０３４３】

（実施例２１６）

２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－（（トリメチルシリル）オキシ）プロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２１２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２１ｍｇ、トリフルオロメチルトリメチルシラン（３５μＬ，６当量）及びフッ化セシウム（１．２ｍｇ，０．２当量）をテトラヒドロフラン（４００μＬ）に溶解し、０℃で３時間攪拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和重曹水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を２２ｍｇ得た。

（ｂ）２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２１６（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－（（トリメチルシリル）オキシ）プロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２２ｍｇから表題の化合物を６．９ｍｇ得た。

【０３４４】

（実施例２１７）

２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チア

ゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２１５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１８ｍｇから表題の化合物を１３ｍｇ得た。

【０３４５】

（実施例２１８）

（Ｅ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム及び（Ｚ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　（Ｅ）－３－（５－（１－（メトキシイミノ）エチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート及びｔｅｒｔ－ブチル　（Ｚ）－３－（５－（１－（メトキシイミノ）エチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２１３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１７ｍｇをＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（０．２ｍＬ）に溶解し、室温で炭酸カリウム（２６ｍｇ，６当量）及びＯ－メチルヒドロキシルアミン塩酸塩（８ｍｇ，３当量）を加え、一晩撹拌した。さらにＯ－メチルヒドロキシルアミン塩酸塩（４ｍｇ，１．５当量）とＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（０．２ｍＬ）を加え６０℃で５時間撹拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、フィルターで濾過した反応液をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を８．２ｍｇ得た。

（ｂ）（Ｅ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム及び（Ｚ）－１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２１８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　（Ｅ）－３－（５－（１－（メトキシイミノ）エチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート及びｔｅｒｔ－ブチル（Ｚ）－３－（５－（１－（メトキシイミノ）エチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート８．０ｍｇから表題の化合物を５．８ｍｇ得た。

【０３４６】

（実施例２１９）

（Ｅ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム及び（Ｚ）－１－（２－（３，６－

ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　（Ｅ）－３－（５－（１－（メトキシイミノ）エチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート及びｔｅｒｔ－ブチル　（Ｚ）－３－（５－（１－（メトキシイミノ）エチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２１８（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２１２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１５ｍｇから表題の化合物を１０ｍｇ得た。

（ｂ）（Ｅ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム及び（Ｚ）－１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オン　Ｏ－メチルオキシム

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、２１９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　（Ｅ）－３－（５－（１－（メトキシイミノ）エチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート及びｔｅｒｔ－ブチル　（Ｚ）－３－（５－（１－（メトキシイミノ）エチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を６．７ｍｇ得た。

【０３４７】

（実施例２２０）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

メチルヨージドに代えてエチルヨージドを用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１１８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２６ｍｇから表題の化合物を１７ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２２０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３５ｍｇから表題の化合物を２４ｍｇ得た。

【０３４８】

（実施例２２１）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール

－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
メチルヨージドに代えてトリフルオロメタンスルホン酸２，２，２－トリフルオロエチルを用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１１８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５１ｍｇから表題の化合物を１４ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２２１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１４ｍｇから表題の化合物を１０ｍｇ得た。
【０３４９】
（実施例２２２）
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１１８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５１ｍｇから表題の化合物を４８ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２２２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－メトキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４８ｍｇから表題の化合物を３０ｍｇ得た。
【０３５０】
（実施例２２３）
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
メチルヨージドに代えて３６当量のトリフルオロメタンスルホン酸２，２，２－トリフ

ルオロエチル及び１９．８当量の水素化ナトリウムを用いたこと以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１２０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６０ｍｇから表題の化合物を５８ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２２３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５８ｍｇから表題の化合物を３５ｍｇ得た。

【０３５１】

（実施例２２４）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

メチルヨージドに代えて３６当量のエチルヨージド及び１９．８当量の水素化ナトリウムを用いたこと以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１２０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５０ｍｇから表題の化合物を２４ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２２４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－エトキシ－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２４ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。

【０３５２】

（実施例２２５）

２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）エタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１４９（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１１８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート６０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１０５ｍｇ得た。

（ｂ）２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）エタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２２５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートの粗生成物１０５ｍｇから表題の化合物を４．２ｍｇ得た。

【０３５３】

（実施例２２６）

２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

メチルヨージドに代えてブロモアセトニトリルを用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１２０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６０ｍｇから表題の化合物を５４ｍｇ得た。

（ｂ）２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２２６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２６ｍｇから表題の化合物を１５ｍｇ得た。

【０３５４】

（実施例２２７）

２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）エタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１４９（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１２０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１９ｍｇ得た。

（ｂ）２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）エタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２２７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物１９ｍｇから表題の化合物を１．６ｍｇ得た。

【０３５５】

（実施例２２８）

２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－

（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

メチルヨージドに代えてブロモアセトニトリルを用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１１８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート６１ｍｇから表題の化合物を５５ｍｇ得た。

（ｂ）２－（１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトニトリル

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２２８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２７ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。

【０３５６】

（実施例２２９）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

メチルヨージドに代えて２－ブロモエチルメチルエーテルを用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１２０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５０ｍｇから表題の化合物を３０ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２２９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を１９ｍｇ得た。

【０３５７】

（実施例２３０）

４－（１－（（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２２８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オ

キサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３０ｍｇ、アジ化ナトリウム（１１ｍｇ，３当量）、塩化アンモニウム（８．８ｍｇ，３当量）をＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（０．６８ｍＬ）に溶解し、マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製）にて、１００℃で４時間撹拌した。ＴＬＣ（展開溶媒、クロロホルム：メタノール：アンモニア水＝４：１：０．１）で生成物を確認した後、蒸留水を加え酢酸エチルで抽出した。抽出した有機層を飽和重曹水で分液し、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール：アンモニア水＝４：１：０．１）で精製して、表題の化合物を２９ｍｇ得た。

（ｂ）４－（１－（（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２３０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２９ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。

【０３５８】

（実施例２３１）

４－（１－（（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２３０（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２２６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（シアノメトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６１ｍｇから表題の化合物を５５ｍｇ得た。

（ｂ）４－（１－（（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２３１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（（１Ｈ－テトラゾール－５－イル）メトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５５ｍｇから表題の化合物を６．４ｍｇ得た。

【０３５９】

（実施例２３２）

１－（（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）メチル）シクロプロパン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（２－（ｔｅｒｔ－ブトキシ）－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１２０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾー

ル－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２５０ｍｇ、テトラブチルアンモニウムクロリド（１３．９ｍｇ，０．１当量）、３５％水酸化ナトリウム水溶液（２．０ｍＬ）及びｔｅｒｔ－ブチル　ブロモアセテート（１１０μＬ，１．５当量）をジクロロメタン（２．０ｍＬ）に溶解し、室温で１９時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を３１９ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２３２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（２－（ｔｅｒｔ－ブトキシ）－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１０ｍｇをテトラヒドロフラン（１６０μＬ）に溶解し、オルトチタン酸テトライソプロピル（９．７μＬ，２当量）及びエチルマグネシウムブロミドの０．９７Ｍテトラヒドロフラン溶液（１０２μＬ，６当量）を加え、室温で４８時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を１．６ｍｇ得た。

（ｃ）１－（（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）メチル）シクロプロパン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２３２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２．６ｍｇから表題の化合物を２．０ｍｇ得た。

【０３６０】

（実施例２３３）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロアセチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１１８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を１０ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１，１－ジオール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２３３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロアセチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を５．７ｍｇ得た。

【０３６１】
（実施例２３４）
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２１で得られた１－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール５００ｍｇから表題の化合物を５７４ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５７４ｍｇから表題の化合物を４９３ｍｇ得た。
（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例１５６（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２３４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２５ｍｇから表題の化合物を粗生成物として２６ｍｇ得た。
（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２３４（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１，１－ジヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２６ｍｇをテトラヒドロフラン（０．５ｍＬ）に溶解し、０℃でメチルマグネシウムブロミドの０．９２Ｍテトラヒドロフラン溶液（０．５４ｍＬ，１０当量）を加え１時間攪拌した。その後室温で９０分攪拌し、ＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（アミノシリカ、ヘキサン：酢酸エチル＝１：４）で精製して、表題の化合物を１４ｍｇ得た。
（ｅ）２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２３４（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１４ｍｇから表題の化合物を４．３ｍｇ得た。

【０３６２】
（実施例２３５）
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２３４（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１４ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２３５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１１ｍｇから表題の化合物を７．２ｍｇ得た。
【０３６３】
（実施例２３６）
２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
実施例１０２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２３３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロアセチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４１ｍｇから表題の化合物を４．２ｍｇ得た。
（ｂ）２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２３６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を５．２ｍｇ得た。
【０３６４】
（実施例２３７）
メチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
（ａ）メチル　７－ブロモ－２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
参考例２２で得られたメチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート２００ｍｇとｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．

２．１］オクタン－８－カルボキシレートより実施例１（ａ）と同様の方法を用いて表題の化合物を２６８ｍｇ得た。

（ｂ）メチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート

実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２３７（ａ）で得られたメチル　７－ブロモ－２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート２２１ｍｇから表題の化合物を８２ｍｇ得た。

（ｃ）メチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２３７（ｂ）で得られたメチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート１９ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。

【０３６５】

（実施例２３８）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボン酸

実施例９４（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２３７（ｃ）で得られたメチル　２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート１２ｍｇから表題の化合物を６．８ｍｇ得た。

【０３６６】

（実施例２３９）

１－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オール

（ａ）メチル　７－ブロモ－２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２２で得られたメチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート５００ｍｇから表題の化合物を５６６ｍｇ得た。

（ｂ）メチル　２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート

実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２３９（ａ）で得られたメチル　７－ブロモ－２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート５６６ｍｇから表題の化合物を３１２ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例２０１（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２３９（ｂ）で得られたメチル　２－（９－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート２５０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［

ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例２０２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２３９（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレートの粗生成物から表題の化合物を１２０ｍｇ得た。

（ｅ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート

実施例１０２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２３９（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１２０ｍｇから表題の化合物を６８ｍｇ得た。

（ｆ）１－（２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２３９（ｅ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１４ｍｇから表題の化合物を１０ｍｇ得た。

【０３６７】

（実施例２４０）

１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オール

（ａ）メチル　７－ブロモ－２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２２で得られたメチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート５００ｍｇから表題の化合物を５０１ｍｇ得た。

（ｂ）メチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート

実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２４０（ａ）で得られたメチル　７－ブロモ－２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート５０８ｍｇから表題の化合物を２９８ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

トルエンに代えてジクロロメタンを用いた以外は実施例２０１（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４０（ｂ）で得られたメチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート２８０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１６８ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２０２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４０（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－

ブチル　３－（４－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物１６８ｍｇから表題の化合物を１６３ｍｇ得た。

（ｅ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２４０（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ホルミル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１７５ｍｇから表題の化合物を１１７ｍｇ得た。

（ｆ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２４０（ｅ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１３ｍｇから表題の化合物を６．８ｍｇ得た。

【０３６８】

（実施例２４１）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２４０（ｅ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１８ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２４１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２２ｍｇから表題の化合物を１４ｍｇ得た。

【０３６９】

（実施例２４２）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例１２４で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１８ｍｇから表題の化合物を１８ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２４２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１８ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。

【０３７０】
（実施例２４３）
２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート
実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２３９（ｅ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１４ｍｇから表題の化合物を１３ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－３－イル）－４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２４３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，９－ジアザビシクロ［３．３．１］ノナン－９－カルボキシレート１３ｍｇから表題の化合物を８．７ｍｇ得た。
【０３７１】
（実施例２４４）
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オン
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例１０２（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２４０（ｅ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１０５ｍｇから表題の化合物を７１ｍｇ得た。
（ｂ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オン
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２４４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１３ｍｇから表題の化合物を４．０ｍｇ得た。
【０３７２】
（実施例２４５）
１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オン
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
実施例１０２（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例１２４で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート７２ｍｇから表題の化合物を６４ｍｇ得た。
（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）エタン－１－オン
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２４５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１４

ｍｇから表題の化合物を４．２ｍｇ得た。

【０３７３】

（実施例２４６）

２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）プロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１７１（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例２４４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６７ｍｇから表題の化合物を３７ｍｇ得た。

（ｂ）２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール４－イル）プロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２４６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１３ｍｇから表題の化合物を４．０ｍｇ得た。

【０３７４】

（実施例２４７）

２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）プロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１７１（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例２４５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－アセチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５１ｍｇから表題の化合物を２７ｍｇ得た。

（ｂ）２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）プロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２４７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を３．３ｍｇ得た。

【０３７５】

（実施例２４８）

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてｔｅｒｔ－ブチル　３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートを用いた以外は実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２３で得られた４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール２．３ｇから表題の化合物を２．９ｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプ

タン－６－カルボキシレート
実施例１（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２．９ｇから表題の化合物を２．５ｇ得た。
（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２４８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１．５ｇをテトラヒドロフラン（６０ｍＬ）に溶解し、アルゴン雰囲気下で２０％水酸化パラジウム／炭素（水分含量５０％）（２．５ｇ）を加え、水素を充填し５０℃で４．５時間攪拌した。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム～クロロホルム：メタノール＝９４：６）で精製して、表題の化合物を１．０ｇ得た。
（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１．０ｇをアセトニトリル（２４ｍＬ）に溶解し、１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］ウンデク－７－エン（３．６ｍＬ，１０当量）とエチル　２－ブロモ－２，２－ジフルオロアセテート（３．１ｍＬ，１０当量）を加え室温で２時間撹拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え反応を停止し、酢酸エチルで３回抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝５：５）で精製して、表題の化合物を１．０ｇ得た。
（ｅ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２４８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート９２ｍｇをテトラヒドロフラン（１．７ｍＬ）に溶解し、０℃でメチルマグネシウムブロミドの０．９５Ｍテトラヒドロフラン溶液（０．８５ｍＬ，５当量）を加えた。室温に昇温後１時間撹拌し、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え反応を停止し、酢酸エチルで３回抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル～酢酸エチル）で精製して、表題の化合物を８２ｍｇ得た。
（ｆ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｅ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５８ｍｇから表題の化合物を３９ｍｇ得た。
【０３７６】

（実施例２４９）

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２１ｍｇをテトラヒドロフラン（３９０μＬ）とメタノール（３９０μＬ）に溶解し、室温で水素化ホウ素ナトリウム（１８ｍｇ，１２当量）を加え４時間攪拌した。飽和塩化アンモニウム水溶液を加え反応を停止し、酢酸エチルで３回抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（ヘキサン：酢酸エチル＝１：２）で精製して、表題の化合物を１５ｍｇ得た。

（ｂ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２４９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１５ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

【０３７７】

（実施例２５０）

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール（ラセミ体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－（メトキシ（メチル）アミノ）－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２００ｍｇとＮ，Ｏ－ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩（１１０ｍｇ，３当量）をテトラヒドロフラン（３．７ｍＬ）に溶解し、０℃でイソプロピルマグネシウムブロミドの２Ｍテトラヒドロフラン溶液（１．１ｍＬ，６当量）を４０分かけて滴下した。反応液を０℃で２０分撹拌後に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え反応を停止し、酢酸エチルで２回抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として２１０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２，２－ジヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２５０（ａ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－（メトキシ（メチル）アミノ）－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２１０ｍｇをテトラヒドロフラン（３．８ｍＬ）に溶解し、０℃でメチルマグネシウムブロミドの０．９５Ｍテトラヒドロフラン溶液（０．８１ｍＬ，２当量）を加え、その温度で３０分撹拌した。飽和塩化アンモニウム水溶

液を加え反応を停止し、酢酸エチルで２回抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として２００ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（ラセミ体）

実施例２５０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２，２－ジヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１９５ｍｇをテトラヒドロフラン（３．７ｍＬ）とメタノール（３．７ｍＬ）に溶解し、０℃で水素化ホウ素ナトリウム（１１３ｍｇ，８当量）を加え、室温で３０分攪拌した。飽和塩化アンモニウム水溶液を加え反応を停止し、酢酸エチルで２回抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣に酢酸エチル（１ｍＬ）を加えた。得られた固体を濾取して表題の化合物を１５０ｍｇ得た。

（ｄ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール（ラセミ体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２５０（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４１ｍｇから表題の化合物を３１ｍｇ得た。

【０３７８】

（実施例２５１）

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール（光学活性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体）

実施例２５０（ｃ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１．４ｇをＹＭＣ社製Ｍｕｌｔｉｐｌｅプレパラティブ ＨＰＬＣ（ＬＣ－ｆｏｒｔｅ／Ｒ）（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝７０：３０，流速１９．８ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が短いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を６８７ｍｇ得た。９９．９％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝７０：３０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：９．８４分

（ｂ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール（光学活性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２５１（ａ）で得られた光学活性体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６８７ｍｇから表題の化合物を４７４ｍｇ得た。９９．９％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：Ｄ

ＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール：ジエチルアミン＝７０：３０：０．１，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１６．８分。

【０３７９】

（実施例２５２）

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール（光学活性体、実施例２５１の鏡像異性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体、実施例２５１（ａ）の鏡像異性体）

実施例２５０（ｃ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１．４ｇをＹＭＣ社製Ｍｕｌｔｉｐｌｅプレパラティブ ＨＰＬＣ（ＬＣ－ｆｏｒｔｅ／Ｒ）（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝７０：３０，流速１９．８ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が長いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を６８８ｍｇ得た。９９．０％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝７０：３０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１２．３分

（ｂ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール（光学活性体、実施例２５１の鏡像異性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２５２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体、実施例２５１（ａ）の鏡像異性体）６２７ｍｇから表題の化合物を４４７ｍｇ得た。９９．０％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール：ジエチルアミン＝７０：３０：０．１，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１４．６分。

【０３８０】

（実施例２５３）

２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）酢酸

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２３２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（２－（ｔｅｒｔ－ブトキシ）－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として得た。その後ギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：Ｓｅｐａｘ　ＧＰ－Ｃ１８（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２．１２ｃｍ，カラム長：１０ｃｍ），展開溶媒、０．１％ギ酸入り水：０．１％ギ酸入りアセトニトリル＝９０：１０～１０：９０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ、検出波長：ＵＶ２５４ｎｍ

）で精製し、凍結乾燥することにより表題の化合物のギ酸塩を２１ｍｇ得た。

【０３８１】

（実施例２５４）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

メチルヨージドに代えてテトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イルトリフルオロメタンスルホネート（０．１０ｍｇ，９．１当量）を用い、水素化ナトリウムを１０当量用いて９０℃で攪拌した以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例８１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０．０ｍｇから表題の化合物を５．５ｍｇ得た。

【０３８２】

（実施例２５５）

１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２３２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（２－（ｔｅｒｔ－ブトキシ）－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４０ｍｇから表題の化合物を３３ｍｇ得た。

（ｂ）１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－(２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２５５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３３ｍｇから表題の化合物を７．９ｍｇ得た。

【０３８３】

（実施例２５６）

２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトアミド

（ａ）メチル　２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセテート

実施例２３２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（２－（ｔｅｒｔ－ブトキシ）－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４４ｍｇに２Ｍの塩酸／メタノール（２．０ｍＬ）を加え、室温で４日間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、反応液を減圧濃縮し得られた残渣を酢酸エチルに溶解させ、飽和重曹水を加えた。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥して、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して表題の化合物を粗生成物として得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－オキソエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

トリフルオロメタンスルホン酸無水物に代えてジ－ｔｅｒｔ－ブチル　ジカーボネートを用いた以外は、実施例８５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２５６（ａ）で得られたメチル　２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセテートの粗生成物から表題の化合物を１６．８ｍｇ得た。

（ｃ）２－（１－（２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）酢酸

実施例９４（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２５６（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－オキソエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１６．８ｍｇから表題の化合物を粗生成物として得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（２－アミノ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２５６（ｃ）で得られた２－（１－（２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）酢酸の粗生成物に、１－エチル－３－（３－ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド塩酸塩（１１．５ｍｇ，２当量）、１－ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物（８．１ｍｇ，２当量）、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（０．５ｍＬ）及び７Ｍアンモニアのメタノール溶液（７１μＬ，１７当量）を加え、室温で３日間攪拌した。さらに７Ｍアンモニアのメタノール溶液（１００μＬ，３３当量）を加え室温で２．５時間攪拌した後、ＴＬＣで生成物を確認し、反応液に酢酸エチル及び水を加えた。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥して、これを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をアミノシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～酢酸エチル～メタノール：酢酸エチル＝１：４）で精製して、表題の化合物を１０．７ｍｇ得た。

（ｅ）２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）アセトアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、２５６（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（２－アミノ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１０．７ｍｇから表題の化合物を８．９ｍｇ得た。

【０３８４】

（実施例２５７）

１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタ

ン－６－カルボキシレート
実施例１２０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１００ｍｇをＮ，Ｎ－ジメチルアセトアミド（１．０ｍＬ）に溶解し、７－メチル－１，５，７－トリアザビシクロ［４．４．０］デカ－５－エン（１４３μＬ，５当量）及びエチル　２－ブロモ－２，２－ジフルオロアセテート（５１μＬ，２当量）を加え、５０℃で１時間攪拌した。７－メチル－１，５，７－トリアザビシクロ［４．４．０］デカ－５－エン（１４３μＬ，５当量）及びエチル　２－ブロモ－２，２－ジフルオロアセテート（１０２μＬ，４当量）を加え、さらに５０℃で１時間攪拌した。反応液に飽和重曹水及び酢酸エチルを加え、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）及びプレパラティブＴＬＣ（酢酸エチル：クロロホルム＝１：６）で精製して、表題の化合物を１９ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例２５７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２３ｍｇから表題の化合物を１６．４ｍｇ得た。
（ｃ）１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、２５７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１６．４ｍｇから表題の化合物を１１．２ｍｇ得た。
【０３８５】
（実施例２５８）
２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２５０（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２５７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を６．１ｍｇ得た。
（ｂ）２－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、２５８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－２，２，２－トリフ

ルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２４ｍｇから表題の化合物を１６．９ｍｇ得た。

【０３８６】

（実施例２５９）

（２Ｒ）－１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）プロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（Ｒ）－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２６ｍｇをＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（０．６ｍＬ）に溶解し、７－メチル－１，５，７－トリアザビシクロ［４．４．０］デカ－５－エン（９．１μＬ，１当量）及び（Ｒ）－プロピレン　オキシド（１７．６μＬ，４当量）を加え、マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製）にて１５０℃で２時間攪拌した。反応液に蒸留水、飽和塩化アンモニウム水溶液及び酢酸エチルを加え、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（メタノール：クロロホルム＝８：９２）で精製して、表題の化合物を２２ｍｇ得た。

（ｂ）（２Ｒ）－１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）プロパン－２－オール（光学活性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、２５９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（Ｒ）－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２２ｍｇから表題の化合物を１３．４ｍｇ得た。

【０３８７】

（実施例２６０）

（２Ｓ）－１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）プロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（Ｓ）－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

（Ｒ）－プロピレン　オキシドに代えて（Ｓ）－プロピレン　オキシドを用いた以外は実施例２５９（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２５ｍｇから表題の化合物を２１ｍｇ得た。

（ｂ）（２Ｓ）－１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）プロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、２６０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（Ｓ）－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２１ｍｇから表題の化合物を１１．６ｍｇ得た。

【０３８８】

（実施例２６１）

１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）プロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－オキソエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２２７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート９７ｍｇから表題の化合物を３１ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドキシプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２６１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－オキソエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３１ｍｇから表題の化合物を９．６ｍｇ得た。

（ｃ）１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）プロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２６１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドキシプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート９．６ｍｇから表題の化合物を５．１ｍｇ得た。

【０３８９】

（実施例２６２）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

ベンジルブロミドの代わりにテトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル　４－メチルベンゼンスルホネート（３当量）を用い、炭酸セシウムを３．５当量用いて９０℃で５時間攪拌した以外は、参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例８１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０．０ｍｇから表題の化合物を９．３ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２６２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート９．３ｍｇから表題の化合物を１．０ｍｇ得た。

【０３９０】

（実施例２６３）
２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（ジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル　４－メチルベンゼンスルホネートに代えてエチル　２－ブロモ－２，２－ジフルオロアセテート（４７．４ｍｇ，５当量）を用いた以外は実施例２６２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例８１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０．０ｍｇから表題の化合物を１１．８ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（ジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２６３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１１．８ｍｇから表題の化合物を８．６ｍｇ得た。
【０３９１】
（実施例２６４）
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２－メチルプロパン－２－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－メトキシ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル　４－メチルベンゼンスルホネートに代えてメチル　２－ブロモアセテートを用いた以外は実施例２６２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例８１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０．０ｍｇから表題の化合物を２１．５ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２６４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－メトキシ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２１．５ｍｇから表題の化合物を１６．１ｍｇ得た。
（ｃ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２－メチルプロパン－２－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２６４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１６．１ｍｇから表題の化合物を１２．０ｍｇ得た。
【０３９２】
（実施例２６５）
１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフ

ルオロエトキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（１，１－ジフルオロ－２－（メトキシ（メチル）アミノ）－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２５０（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２５７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を７．４ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（１，１－ジフルオロ－２－オキソプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２５０（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２６５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（１，１－ジフルオロ－２－（メトキシ（メチル）アミノ）－２－オキソエトキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート７．４ｍｇから表題の化合物の粗生成物を得た。
（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２５０（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２６５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（１，１－ジフルオロ－２－オキソプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物から表題の化合物を６．５ｍｇ得た。
（ｄ）１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、２６５（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６．５ｍｇから表題の化合物を３．４ｍｇ得た。
【０３９３】
（実施例２６６）
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロブタン－１－カルボニトリル
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（３－シアノシクロブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
ベンジルブロミドに代えて３－シアノシクロブチル　４－メチルベンゼンスルホネートを用い、６０℃で攪拌した以外は、参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物の粗生成物を３３ｍｇ得た。
（ｂ）３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７

－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロブタン－１－カルボニトリル

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、２６６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（３－シアノシクロブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物１５ｍｇから表題の化合物を７．４ｍｇ得た。

【０３９４】

（実施例２６７）

２－（３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロブチル）プロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（３－（エトキシカルボニル）シクロブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ベンジルブロミドに代えてエチル　３－（トシルオキシ）シクロブタン－１－カルボキシレートを用い、６０℃で攪拌した以外は参考例２３（ａ）と同様の方法で、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４５ｍｇから表題の化合物を５２ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（３－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）シクロブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２６７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（３－（エトキシカルボニル）シクロブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５２ｍｇから表題の化合物の粗生成物を得た。

（ｃ）２－（３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロブチル）プロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２６７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（３－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）シクロブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物から表題の化合物を７．２ｍｇ得た。

【０３９５】

（実施例２６８）

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２－メチルプロパン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（１－エトキシ－２－メチル－１－オキソプロパン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ヒドロキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１．０ｇをアセトニトリル（２．４ｍＬ）に溶解し、炭酸カリウム（６６ｍｇ，２当量）とエチル　２－ブロモ－２－メチルプロパノエート（７１μＬ，２当量）を加え８０℃で１７時間撹拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、飽和重曹水を加え反応を停止し、酢酸エチルで３回抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥したものを濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を１０９ｍｇ

得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
水素化ホウ素ナトリウムを３１当量用いた以外は、実施例２５０（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２６８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（１－エトキシ－２－メチル－１－オキソプロパン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。
（ｃ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２－メチルプロパン－１－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２６８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（１－ヒドロキシ－２－メチルプロパン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１６ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。
【０３９６】
（実施例２６９）
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）シクロプロパン－１－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシシクロプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
エチルマグネシウムブロミドの０．９７Ｍテトラヒドロフラン溶液（６当量）に代えて、メチルマグネシウムブロミドの０．９８Ｍテトラヒドロフラン溶液（４当量）及びエチルマグネシウムブロミドの０．９７Ｍテトラヒドロフラン溶液（６当量）を用い、室温で４０分攪拌した以外は、実施例２３２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１８７（ｂ）で得られたエチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート５５ｍｇから表題の化合物を１３．４ｍｇ得た。
（ｂ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）シクロプロパン－１－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、２６９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシシクロプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１３ｍｇから表題の化合物を６．５ｍｇ得た。
【０３９７】
（実施例２７０）
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール（光学活性体）
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体）

実施例２３４（ｄ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート７２ｍｇをギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９５：５～８０：２０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が短いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を２８ｍｇ得た。９９．９％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９０：１０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１２．７分

（ｂ）２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール（光学活性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２７０（ａ）で得られた光学活性体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２８ｍｇから表題の化合物を１９ｍｇ得た。

【０３９８】

（実施例２７１）

２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール（実施例２７０の鏡像異性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（実施例２７０の（ａ）鏡像異性体）

実施例２７０（ａ）で精製した、保持時間が長いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を３１ｍｇ得た。９９．９％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９０：１０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１６．８分

（ｂ）２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール（実施例２７０の鏡像異性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２７１（ａ）で得られた光学活性体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（１，１，１－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３１ｍｇから表題の化合物を２０ｍｇ得た。

【０３９９】

（実施例２７２）

１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール（光学活性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，

６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体）

実施例２０３（ｂ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート８４．９ｍｇをギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝８０：２０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が短いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を３２．７ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール（光学活性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２７２（ａ）で得られた光学活性体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３２．７ｍｇから表題の化合物を１９．３ｍｇ得た。＞９９．５％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール：ジエチルアミン＝７０：３０：０．１，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１１．６分。

【０４００】

（実施例２７３）

１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール（光学活性体、実施例２７２の鏡像異性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体、実施例２７２（ａ）の鏡像異性体）

実施例２７２（ａ）で精製した保持時間が長いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を３５．４ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール（光学活性体、実施例２７２の鏡像異性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、２７３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体、実施例２７２（ａ）の鏡像異性体）３５．４ｍｇから表題の化合物を１９．７ｍｇ得た。８９．７％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール：ジエチルアミン＝７０：３０：０．１，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１５．４分。

【０４０１】

（実施例２７４）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）シクロプロパン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシシクロプロピル）－７－（チアゾ

ール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

エチルマグネシウムブロミドの０．９７Ｍテトラヒドロフラン溶液（６当量）に代えて、メチルマグネシウムブロミドの０．９８Ｍテトラヒドロフラン溶液（４当量）及びエチルマグネシウムブロミドの０．９７Ｍテトラヒドロフラン溶液（６当量）を用い、室温で１時間攪拌した以外は、実施例２３２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例１８６（ｂ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート５７ｍｇから表題の化合物を１０．６ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）シクロプロパン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、２７４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシシクロプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を１０．８ｍｇ得た。

【０４０２】

（実施例２７５）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（光学活性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（光学活性体）

実施例２０６（ａ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２１ｍｇをギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝９０：１０～７０：３０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が短いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を９．９ｍｇ得た。＞９９．５％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝８０：２０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：５．８分

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（光学活性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２７５（ａ）で得られた光学活性体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート８．０ｍｇから表題の化合物を５．３ｍｇ得た。

【０４０３】

（実施例２７６）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チア

ゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（光学活性体、実施例２７５の鏡像異性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（光学活性体、実施例２７５（ａ）の鏡像異性体）

実施例２７５（ａ）で精製した保持時間が長いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を１０．９ｍｇ得た。＞９９．５％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝８０：２０：，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１１．６分

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（光学活性体、実施例２７５の鏡像異性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、２７６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（光学活性体、実施例２７５（ａ）の鏡像異性体）９．５ｍｇから表題の化合物を５．７ｍｇ得た。

【０４０４】

（実施例２７７）

３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル　４－メチルベンゼンスルホネートに代えて３－ブロモ－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オールを用いた以外は実施例２６２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０．０ｍｇから表題の化合物を３．５ｍｇ得た。

（ｂ）３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１，１－トリフルオロプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２７７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（３，３，３－トリフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３．５ｍｇから表題の化合物を２．８ｍｇ得た。

【０４０５】

（実施例２７８）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］

ヘプタン－６－カルボキシレート
テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル　４－メチルベンゼンスルホネートに代えてエチル　２－ブロモ－２，２－ジフルオロアセテートを用いた以外は実施例２６２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０．０ｍｇから表題の化合物を１２．０ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２７８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１２．０ｍｇから表題の化合物を９．１ｍｇ得た。
【０４０６】
（実施例２７９）
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２－メチルプロパン－２－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－メトキシ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル　４－メチルベンゼンスルホネートに代えてメチル　２－ブロモアセテートを用いた以外は実施例２６２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０．０ｍｇから表題の化合物を２０．４ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２７９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－メトキシ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０．４ｍｇから表題の化合物を２０．０ｍｇ得た。
（ｃ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２－メチルプロパン－２－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２７９（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０．０ｍｇから表題の化合物を１５．３ｍｇ得た。
【０４０７】
（実施例２８０）
３－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２，３－ジメチルブタン－２－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（（１－エトキシ－２－メチル－１－オキソプロパン－２－イル）オキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

炭酸カリウムを９当量、エチル　２－ブロモ－２－メチルプロパノエートを９当量用いた以外は、実施例２７１（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１２０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４０ｍから表題の化合物を３３ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（（３－ヒドロキシ－２，３－ジメチルブタン－２－イル）オキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２８０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１－（（１－エトキシ－２－メチル－１－オキソプロパン－２－イル）オキシ）－２，２，２－トリフルオロエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３３ｍｇから表題の化合物を１５ｍｇ得た。

（ｃ）３－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２，３－ジメチルブタン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２８０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（（３－ヒドロキシ－２，３－ジメチルブタン－２－イル）オキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１５ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

【０４０８】

（実施例２８１）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２５５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４２ｍｇから表題の化合物を２５ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２８１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２５ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。

【０４０９】

（実施例２８２）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－メトキシシクロプロピル）メトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－メトキシシクロプロピル）メトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２３２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３６ｍｇから表題の化合物を３０ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－メトキシシクロプロピル）メトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２８２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－メトキシシクロプロピル）メトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。

【０４１０】

（実施例２８３）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシシクロプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－メトキシシクロプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

水素化ナトリウムを６当量用いた以外は実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２６９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシシクロプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１５ｍｇから表題の化合物を１０．８ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（１－メトキシシクロプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２８３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－メトキシシクロプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１０．８ｍｇから表題の化合物を８．６ｍｇ得た。

【０４１１】

（実施例２８４）

１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－４－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例８（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２６９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシシクロプロピル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１５ｍｇから表題の化合物を１０

．８ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－４－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－オキソエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
ブロモアセトニトリルに代えてメチル　ブロモアセテートを用い５０℃で攪拌した以外は実施例７３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２８４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－４－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１８２ｍｇから表題の化合物を１３６ｍｇ得た。
（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－４－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２８４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－４－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－オキソエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６７ｍｇから表題の化合物を４６ｍｇ得た。
（ｄ）１－（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）－２－メチルプロパン－２－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２８４（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－４－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４５ｍｇから表題の化合物を３３ｍｇ得た。
【０４１２】
（実施例２８５）
３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロブタン－１－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（３－（ベンジルオキシ）シクロブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
ベンジルブロミドの代わりに３－（ベンジルオキシ）シクロブチル　４－メチルベンゼンスルホネートを用い、６０℃で攪拌した以外は参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を８３ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（３－ヒドロキシシクロブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２４８（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２８５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（３－（ベンジルオキシ）シクロブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート８３ｍｇから表題の化合物を２４ｍｇ得た。
（ｃ）３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７

－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロブタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２８５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（３－ヒドロキシシクロブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２４ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

【０４１３】

（実施例２８６）

１－（（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）メチル）シクロプロパン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－４－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２３２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２８４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－４－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（２－メトキシ－２－オキソエトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６３ｍｇから表題の化合物を３４ｍｇ得た。

（ｂ）１－（（１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエトキシ）メチル）シクロプロパン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２８６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－４－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－（（１－ヒドロキシシクロプロピル）メトキシ）エチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３４ｍｇから表題の化合物を１８ｍｇ得た。

【０４１４】

（実施例２８７）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）エチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例８（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１８７（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ－２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２７５ｍｇから表題の化合物を２５０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１２６（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２８７（ａ）で得られたエチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート１２０ｍｇから表題の化合物を９７ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イ

ル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２８７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４５ｍｇから表題の化合物を３８ｍｇ得た。
（ｄ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２８７（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３７ｍｇから表題の化合物を３１ｍｇ得た。
【０４１５】
（実施例２８８）
２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２８７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３７ｍｇから表題の化合物を２２ｍｇ得た。
【０４１６】
（実施例２８９）
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）（０．２当量）、２－（トリブチルスタンニル）ピリジン（８．０当量）を用い、マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製）にて攪拌１２０℃で２時間攪拌した以外は、実施例７（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６０ｍｇから表題の化合物を５０ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２４８（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２８９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１１０ｍｇから表題の化合物９４ｍｇを粗生成物として得た。
（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例２８９（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物９４ｍｇから表題の化合物を４２ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

メチルマグネシウムブロミドの０．９５Ｍテトラヒドロフラン溶液（６当量）を用いた以外は実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２８９（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４２ｍｇから表題の化合物を粗生成物として得た。

（ｅ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２８９（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物から表題の化合物を２４ｍｇ得た。

【０４１７】

（実施例２９０）

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例９（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５０ｍｇから表題の化合物を３１ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２９０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を２６ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例２９０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２６ｍｇから表題の化合物を１４ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２９０（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－

（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１４ｍｇから表題の化合物を９．９ｍｇ得た。

（ｅ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２９０（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート９．９ｍｇから表題の化合物を５．２ｍｇ得た。

【０４１８】

（実施例２９１）

２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール

（ａ）エチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート

実施例８（ａ）と同様の方法を用いて、実施例１８６（ａ）で得られたエチル　７－ブロモ２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート５６４ｍｇから表題の化合物を５５３ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２９１（ａ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を１７９ｍｇ得た。

（ｃ）２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２９１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート７９ｍｇから表題の化合物を６４ｍｇ得た。

【０４１９】

（実施例２９２）

１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（光学活性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体）

実施例２０７（ａ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオ

ロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１０１ｍｇをギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝８０：２０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が短いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を３２ｍｇ得た。９９．９％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝８０：２０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：７．８分

（ｂ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（光学活性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２９２（ａ）で得られた光学活性体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３２ｍｇから表題の化合物を２６ｍｇ得た。

【０４２０】

（実施例２９３）

１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（実施例２９２の鏡像異性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（実施例２９２（ａ）の鏡像異性体）

実施例２９２（ａ）で精製した、保持時間が長いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を２９ｍｇ得た。９９．９％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝８０：２０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：２０．４分

（ｂ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（実施例２９２の鏡像異性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２９３（ａ）で得られた光学活性体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２９ｍｇから表題の化合物を２２ｍｇ得た。

【０４２１】

（実施例２９４）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル　４－メチルベンゼンスルホネートに代えてテ

トラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル　４－メチルベンゼンスルホネートを用いた以外は実施例２６２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５０．０ｍｇから表題の化合物を５９．４ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２９４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－４－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５９．４ｍｇから表題の化合物を３９．７ｍｇ得た。

【０４２２】

（実施例２９５）

４－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－４，４－ジフルオロ－２－メチルブタン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（３－エトキシ－１，１－ジフルオロ－３－オキソプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

エチル　２－ブロモ－２，２－ジフルオロアセテートに代えてエチル　３－ブロモ－３，３－ジフルオロプロパノエートを用いた以外は実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５０．０ｍｇから表題の化合物を４１．３ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２９５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（３－エトキシ－１，１－ジフルオロ－３－オキソプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４１．３ｍｇから表題の化合物を１４．４ｍｇ得た。

（ｃ）４－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－４，４－ジフルオロ－２－メチルブタン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２９５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１４．４ｍｇから表題の化合物を９．２ｍｇ得た。

【０４２３】

（実施例２９６）

２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール（光学活性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３

，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体）

実施例１２６（ｂ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４５ｍｇをギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝８０：２０～５０：５０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が短いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を１９ｍｇ得た。＞９９．５％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：エタノール＝８０：２０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：８．２分

（ｂ）２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール（光学活性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２９６（ａ）で得られた光学活性体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１９ｍｇから表題の化合物を１５ｍｇ得た。

【０４２４】

（実施例２９７）

２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール（光学活性体、実施例２９６の鏡像異性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体、実施例２９６（ａ）の鏡像異性体）

実施例２９６（ａ）で精製した保持時間が長いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を１８ｍｇ得た。＞９９．５％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：エタノール＝８０：２０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１１．２分

（ｂ）２－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール（光学活性体、実施例２９６の鏡像異性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２９７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体、実施例２９６（ａ）の鏡像異性体）１８ｍｇから表題の化合物を１４ｍｇ得た。

【０４２５】

（実施例２９８）

２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イ

ル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２９１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート９８ｍｇから表題の化合物を９５ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２９８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２－メトキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート９５ｍｇから表題の化合物を５４ｍｇ得た。
【０４２６】
（実施例２９９）
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）シクロプロパン－１－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシシクロプロピル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシラート
実施例２３２（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例２８７（ａ）で得られたエチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート８０ｍｇから表題の化合物を１９ｍｇ得た。
（ｂ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）シクロプロパン－１－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２９９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（１－ヒドロキシシクロプロピル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシラート２５ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。
【０４２７】
（実施例３００）
１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（光学活性体）
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２０１（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２８７（ａ）で得られたエチル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート２７０ｍｇから表題の化合物を粗生成物として１５２ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシク

ロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２０２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３００（ａ）で得られた粗生成物のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ヒドロキシメチル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１５１ｍｇから表題の化合物を１１４ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１８３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３００（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１１４ｍｇから表題の化合物を７７ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（光学活性体）

実施例３００（ｃ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート７６ｍｇをギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝７０：３０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が短いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を３２ｍｇ得た。９９．９％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝７０：３０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：５．９分

（ｅ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（光学活性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３００（ｄ）で得られた光学活性体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３２ｍｇから表題の化合物を２３ｍｇ得た。

【０４２８】

（実施例３０１）

１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（実施例３００の鏡像異性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート（実施例３００（ｄ）の鏡像異性体）

実施例３００（ｃ）で精製した、保持時間が長いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を３１ｍｇ得た。９９．９％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０

．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝７０：３０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１７．３分

（ｂ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（実施例３００の鏡像異性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３０１（ａ）で得られた光学活性体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３１ｍｇから表題の化合物を２３ｍｇ得た。

【０４２９】

（実施例３０２）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（光学活性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２９１（ａ）で得られたエチル　２－（８－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボキシレート３５０ｍｇから表題の化合物の粗生成物を２４１ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

トリフェニルホスフィンを４当量及び（ブロモジフルオロメチル）トリメチルシランを４当量用いた以外は、実施例１８３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３０２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ホルミル－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートの粗生成物２４０ｍｇから表題の化合物を１９６ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（光学活性体）

実施例３０２（ｂ）で得られたラセミ体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０３ｍｇをギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝８０：２０～７０：３０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が短いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を５２ｍｇ得た。＞９９．５％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝８０：２０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：５．９分

（ｄ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（光学活性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３０２（ｃ）で得られた光学活性体のｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５２ｍｇから表題の化合物を２７ｍｇ得た。

【０４３０】

（実施例３０３）

１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（光学活性体、実施例３０２の鏡像異性体）

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（光学活性体、実施例３０２（ｃ）の鏡像異性体）

実施例３０２（ｃ）で精製した保持時間が長いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を５０ｍｇ得た。＞９９．５％ｅｅ。分析条件：ＨＩＴＡＣＨＩ社製ＨＰＬＣ（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＡ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ０．４６ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール＝８０：２０，流速１ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ，温度２５℃），保持時間：１５．１分

（ｂ）１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール（光学活性体、実施例３０２の鏡像異性体）

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３０３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（２，２－ジフルオロ－１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－４－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート（光学活性体、実施例３０２（ｃ）の鏡像異性体）５０ｍｇから表題の化合物を２５ｍｇ得た。

【０４３１】

（実施例３０４）

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

１２０℃で１５時間攪拌した以外は実施例５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を２５ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３０４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［

ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３８ｍｇから表題の化合物を９．７ｍｇ得た。

（ｃ）２－（（２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ酢酸

シリカゲルカラムクロマトグラフィーの溶出溶媒にクロロホルム～クロロホルム：メタノール：アンモニア＝４：１：０．１を用いた以外は、実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３０４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート９０ｍｇから表題の化合物を９１ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３０４（ｃ）で得られた２－（（２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ酢酸６９ｍｇをクロロホルム／エタノール＝１／１（２．８ｍＬ）に溶解し、アルゴン雰囲気下でトリフルオロ酢酸（３２０μＬ，３０当量）を加え６０℃で２４時間攪拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え反応を停止し、酢酸エチルで３回抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥したものを濾過し、減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン＝１：９～酢酸エチル：ヘキサン＝１：１）で精製して、表題の化合物を３５ｍｇ得た。

（ｅ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３０４（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３５ｍｇから表題の化合物を９．０ｍｇ得た。

（ｆ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３０４（ｅ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート９．０ｍｇから表題の化合物を４．１ｍｇ得た。

【０４３２】

（実施例３０５）

４－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロヘキサン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（４－オキソシクロヘキシル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ベンジルブロミドに代えて４－オキソシクロヘキシル　４－メチルベンゼンスルホネートを用い、６０℃で攪拌した以外は参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－

イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４１ｍｇから表題の化合物の粗生成物を３５ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（４－ヒドロキシシクロヘキシル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

水素化ホウ素ナトリウムを１当量用いた以外は、実施例１５５（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３０５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（４－オキソシクロヘキシル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４１ｍｇから表題の化合物を２２ｍｇ得た。

（ｃ）４－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）シクロヘキサン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３０５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（４－ヒドロキシシクロヘキシル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２２ｍｇから表題の化合物を７．５ｍｇ得た。

【０４３３】

（実施例３０６）

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－（トリブチルスタンニル）フランの代わりに４－メチル－２－（トリブチルスタンニル）チアゾールを用いた以外は実施例６（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を２０９ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３０６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０９ｍｇから表題の化合物を１０７ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３０６（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１０７ｍｇから表題の化合物を９８ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３０６（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－

ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート９８ｍｇから表題の化合物を７５ｍｇ得た。

（ｅ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３０６（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート７５ｍｇから表題の化合物を３４ｍｇ得た。

【０４３４】

（実施例３０７）

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２４で得られた７－ブロモ－４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１．０ｇから表題の化合物を５９０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例８（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３０７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を２１２ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３０７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２１２ｍｇをテトラヒドロフラン（４．０ｍＬ）に溶解し、１．０Ｍテトラブチルアンモニウムフルオリドのテトラヒドロフラン溶液（０．８ｍＬ，２．０当量）を加え０℃で１時間撹拌した。ＴＬＣで生成物を確認した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え反応を停止し、酢酸エチルで３回抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥したものを濾過し、減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～酢酸エチル：ヘキサン＝１：１）で精製して、表題の化合物を１４５ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３０７（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１４５ｍｇから表題の化合物を１０７ｍｇ得た。

（ｅ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３０７（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５４ｍｇから表題の化合物を３４ｍｇ得た。

（ｆ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３０７（ｅ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３４ｍｇから表題の化合物を９．８ｍｇ得た。

【０４３５】

（実施例３０８）

１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２４で得られた７－ブロモ－４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール１．０ｇから表題の化合物を８８４ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例８（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３０８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４４２ｍｇから表題の化合物を１８９ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例３０７（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３０８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル）オキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１８９ｍｇから表題の化合物を１１５ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３０８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１１５ｍｇから表題の化合物を１１１ｍｇ得た。

（ｅ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３０８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－

（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５６ｍｇから表題の化合物を３６ｍｇ得た。

（ｆ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３０８（ｅ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３６ｍｇから表題の化合物を１４ｍｇ得た。

【０４３６】

（実施例３０９）

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－（メトキシ（メチル）アミノ）－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２５０（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３０７（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５４ｍｇから表題の化合物を２９ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－オキソプロポキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２５０（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３０９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－（メトキシ（メチル）アミノ）－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２９ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２５０（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３０９（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－オキソプロポキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１６ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。

（ｄ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３０９（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１６ｍｇから表題の化合物を７．６ｍｇ得た。

【０４３７】

（実施例３１０）

１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チ

アゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－（メトキシ（メチル）アミノ）－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２５０（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３０８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５４ｍｇから表題の化合物を２９ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－オキソプロポキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２５０（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３１０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－（メトキシ（メチル）アミノ）－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２９ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２５０（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－オキソプロポキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３９ｍｇから表題の化合物を２１ｍｇ得た。

（ｄ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１０（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１４ｍｇから表題の化合物を１．９ｍｇ得た。

【０４３８】

（実施例３１１）

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４９（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３０７（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物５４ｍｇから表題の化合物を３５ｍｇ得た。

（ｂ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチ

ル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３１ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

【０４３９】

（実施例３１２）

２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４９（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３０８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート６８ｍｇから表題の化合物を３７ｍｇ得た。

（ｂ）２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（チアゾール－４－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３１ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

【０４４０】

（実施例３１３）

３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－４，４，４－トリフルオロ－２－メチルブタン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－ブロモ－３－エトキシ－１，１，１－トリフルオロ－３－オキソプロパン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

エチル　２－ブロモ－２，２－ジフルオロアセテートに代えてエチル　２－ブロモ－２，３，３，３－テトラフルオロプロパノエートを用いた以外は２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５０．０ｍｇから表題の化合物を７５．８ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（３－エトキシ－１，１，１－トリフルオロ－３－オキソプロパン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

１０％パラジウム／炭素（５０ｍｇ）を用いた以外は、実施例２４８（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－ブロモ－３－エトキシ－１，１，１－トリフルオロ－３－オキソプロパン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート７５．８ｍｇから表題の化合物を３９．４ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブタン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オ

キサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３１３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（３－エトキシ－１，１，１－トリフルオロ－３－オキソプロパン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３９．４ｍｇから表題の化合物を３１．１ｍｇ得た。

（ｄ）３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－４，４，４－トリフルオロ－２－メチルブタン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１３（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（１，１，１－トリフルオロ－３－ヒドロキシ－３－メチルブタン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６．４ｍｇから表題の化合物を５．２ｍｇ得た。

【０４４１】

（実施例３１４）

４－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）テトラヒドロ－２Ｈ－チオピラン　１，１－ジオキシド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（１，１－ジオキシドテトラヒドロ－２Ｈ－チオピラン－４－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル　４－メチルベンゼンスルホネートに代えて１，１－ジオキシドテトラヒドロ－２Ｈ－チオピラン－４－イル　４－メチルベンゼンスルホネートを用いた以外は実施例２６２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５０．０ｍｇから表題の化合物を６５．５ｍｇ得た。

（ｂ）４－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）テトラヒドロ－２Ｈ－チオピラン　１，１－ジオキシド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（１，１－ジオキシドテトラヒドロ－２Ｈ－チオピラン－４－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６５．５ｍｇから表題の化合物を５２．５ｍｇ得た。

【０４４２】

（実施例３１５）

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例７（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１．４ｇから、表題の化合物を９３０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［

ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２０％水酸化パラジウム／炭素（水分含量５０％）に代えて１０％パラジウム／炭素を用い、テトラヒドロフランに代えてエタノール及び酢酸エチルを用い、室温で撹拌した以外は、実施例２４８（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート９００ｍｇから表題の化合物の粗生成物を６５０ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３１５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物６８０ｍｇから表題の化合物を３５０ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

室温で撹拌した以外は、実施例１５５（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１５（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３００ｍｇから表題の化合物を１８０ｍｇ得た。

（ｅ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

クロロホルムに代えてジクロロメタンを用いた以外は、実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１５（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１８０ｍｇから表題の化合物を１００ｍｇ得た。

【０４４３】

（実施例３１６）

１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１（ａ）と同様の方法を用いて、参考例２３で得られた４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－チオール２．０ｇから表題の化合物を３．０ｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３１６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０１ｍｇから表題の化合物を４０ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）

ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１６（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４０ｍｇから表題の化合物を３１ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３１６（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３１ｍｇから表題の化合物を３４ｍｇ得た。

（ｅ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３１６（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３４ｍｇから表題の化合物を１６ｍｇ得た。

（ｆ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１６（ｅ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１６ｍｇから表題の化合物を９．９ｍｇ得た。

【０４４４】

（実施例３１７）

１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例７（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３１６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０１ｍｇから表題の化合物を８２ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート８２ｍｇから表題の化合物を５１ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，

８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３１７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５１ｍｇから表題の化合物を４２ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３１７（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４２ｍｇから表題の化合物を３７ｍｇ得た。

（ｅ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１７（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（ピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３７ｍｇから表題の化合物を２２ｍｇ得た。

【０４４５】

（実施例３１８）

１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例３０６（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３１６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を１０１ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０１ｍｇから表題の化合物を６９ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３１８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート６９ｍｇから表題の化合物を６６ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３１８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート６６ｍｇから表題の化合物を１４ｍｇ得た。

（ｅ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（４－メチルチアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１４ｍｇから表題の化合物を５．７ｍｇ得た。

【０４４６】

（実施例３１９）

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えて（５－フルオロピリジン－２－イル）ボロン酸を、炭酸カリウムに代えて炭酸セシウムを、２－ブロモ－５－フルオロピリジンに代えて実施例２４８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５０ｍｇを用い、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド中で攪拌した以外は、実施例１０（ｂ）と同様の方法を用いて表題の化合物を３０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（５－フルオロピリジン－２－イル）－４－ヒドロキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３１５（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３１９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３６０ｍｇから表題の化合物の粗生成物を３１０ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３１９（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（５－フルオロピリジン－２－イル）－４－ヒドロキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物２６０ｍｇから表題の化合物を１７０ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

室温で攪拌した以外は、実施例１５５（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３１９（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１７０ｍｇから表題の化合物を１１０ｍｇ得た。

（ｅ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

実施例３１５（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３１９（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１１０ｍｇから表題の化合物を６０ｍｇ得た。

【０４４７】

（実施例３２０）

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１５（ａ）と同様の方法を用いて実施例２４８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２．０ｇから、表題の化合物を１．３ｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３１５（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３２０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート９００ｍｇから表題の化合物の粗生成物を２５０ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３２０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物１．４ｇから表題の化合物を１．０ｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

室温で攪拌した以外は、実施例１５５（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３２０（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３５０ｍｇから表題の化合物を２５０ｍｇ得た。

（ｅ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

実施例３１５（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３２０（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（１Ｈ－ピラゾール－１－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ

［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２５０ｍｇから表題の化合物を１３０ｍｇ得た。

【０４４８】

（実施例３２１）

１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例９（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３１６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１５０ｍｇから表題の化合物を９８ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３２１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート９８ｍｇから表題の化合物を７２ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３２１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート７２ｍｇから表題の化合物を６８ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３２１（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート６８ｍｇから表題の化合物を６５ｍｇ得た。

（ｅ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３２１（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（オキサゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート６５ｍｇから表題の化合物を５４ｍｇ得た。

【０４４９】

（実施例３２２）

１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（２Ｈ－１，２，３－ト

リアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

１Ｈ－ピラゾールに代えて１Ｈ－１，２，３－トリアゾールを用いた以外は実施例５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３１６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１５０ｍｇから表題の化合物を１００ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３２２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５６ｍｇから表題の化合物を７４ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３２２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート７４ｍｇから表題の化合物を８４ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３２２（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート８４ｍｇから表題の化合物を５６ｍｇ得た。

（ｅ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３２２（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（２Ｈ－１，２，３－トリアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５６ｍｇから表題の化合物を３２ｍｇ得た。

【０４５０】

（実施例３２３）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（（Ｓ）－テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（（Ｓ）－テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ベンジルブロミドに代えて（Ｒ）－テトラヒドロフラン－３－イル　４－メチルベンゼンスルホネートを用い、６０℃で攪拌した以外は参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チア

ゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を３３ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（（Ｓ）－テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３２３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（（Ｓ）－テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３３ｍｇから表題の化合物を１９ｍｇ得た。

【０４５１】

（実施例３２４）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（（Ｒ）－テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（（Ｒ）－テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ベンジルブロミドに代えて（Ｓ）－テトラヒドロフラン－３－イル　４－メチルベンゼンスルホネートを用い、６０℃で撹拌した以外は参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３１ｍｇから表題の化合物を３４ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（（Ｒ）－テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３２４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（（Ｒ）－テトラヒドロフラン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３２ｍｇから表題の化合物を２１ｍｇ得た。

【０４５２】

（実施例３２５）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（オキセタン－３－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（オキセタン－３－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ベンジルブロミドに代えてオキセタン－３－イル　４－メチルベンゼンスルホネートを用い、６０℃で撹拌した以外は参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を２６ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（オキセタン－３－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３２５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（オキセタン－３－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２６ｍｇから表題の化合物を８．９ｍｇ得た。

【０４５３】

（実施例３２６）

３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロ－２－メチルプロパン－１，２－ジオール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ジフルオロ（２－メチルオキシラン－２－イル）メトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２５０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２，２－ジヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１０１．３ｍｇをＤＭＳＯ（１ｍＬ）に溶解し、トリメチルスルホキソニウム　ヨージド（５２．８ｍｇ，１．２当量）及びカリウムｔｅｒｔ－ブトキシド（２６．９ｍｇ，１．２当量）を加え、室温で１時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液及び酢酸エチルを加え、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を６４．３ｍｇ得た。

（ｂ）３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロ－２－メチルプロパン－１，２－ジオール

室温で終夜攪拌した以外は実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、３２６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ジフルオロ（２－メチルオキシラン－２－イル）メトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６４．３ｍｇから表題の化合物を４８．９ｍｇ得た。

【０４５４】

（実施例３２７）

１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３１６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１．０ｇから表題の化合物を６９５ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

２－ブロモ－５－フルオロピリジンに代えて５－ブロモ－１，２，４－チアジアゾールを用いた以外は、実施例１０（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３２７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０１ｍｇから、表題の化合物を６０ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

テトラヒドロフランに代えてメタノールを、また水素に代えてギ酸アンモニウムを用いた以外は、実施例２４８（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３２７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（１，２，４－チアジアゾール－

５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート５９ｍｇから表題の化合物を２４ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３２７（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２３ｍｇから表題の化合物を２０ｍｇ得た。

（ｅ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

０．９５Ｍメチルマグネシウムブロミドのテトラヒドロフラン溶液（０．３６ｍＬ，１０当量）に、実施例３２７（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１９ｍｇのテトラヒドロフラン溶液０．５ｍＬを０℃で加えた。室温に昇温後２．５時間撹拌し、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え反応を停止し、酢酸エチルで３回抽出した。有機層を減圧濃縮し、表題の化合物の粗生成物を１９ｍｇ得た。

（ｆ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３２７（ｅ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートの粗生成物１９ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

【０４５５】

（実施例３２８）

１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

２－ブロモ－５－フルオロピリジンに代えて３－ブロモ－１－メチル－１Ｈ－ピラゾールを用いた以外は、実施例１０（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３２７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート９１ｍｇから、表題の化合物を７０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例３２７（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３２８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート７０ｍｇから表題の化合物を４６ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３２８（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４６ｍｇから表題の化合物を３１ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例３２７（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３２８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２９ｍｇから表題の化合物の粗生成物を２９ｍｇ得た。

（ｅ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３２８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートの粗生成物２８ｍｇから表題の化合物を１７ｍｇ得た。

【０４５６】

（実施例３２９）

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

０．９５Ｍメチルマグネシウムブロミドのテトラヒドロフラン溶液に代えて、３Ｍメチルマグネシウムブロミドのジエチルエーテル溶液を用いた以外は、実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３１９（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（５－フルオロピリジン－２－イル）－４－ヒドロキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート９３０ｍｇから表題の化合物を６７０ｍｇ得た。

（ｂ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例３１５（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３２９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１５０ｍｇから表題の化合物を８０ｍｇ得た。

【０４５７】

（実施例３３０）

１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（ピ

リミジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－ヒドロキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例３１６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート９９６ｍｇをクロロホルム（１０ｍＬ）に溶解し、０℃で１．０Ｍ三塩化ホウ素のヘプタン溶液（９．７ｍＬ，５当量）を加え、０℃で１時間撹拌した。メタノール及び水を加え、次に５Ｎ水酸化ナトリウム水溶液（４．４ｍＬ）及びジ－ｔｅｒｔ－ブチル　ジカーボネート（０．４９ｍＬ，１．１当量）を加え、室温で一晩撹拌した。さらに５Ｎ水酸化ナトリウム水溶液（１．６ｍＬ）を加え３時間室温で撹拌した後、５％硫酸水素カリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。これを減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン～ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を５８９ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３３０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－ヒドロキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート９９ｍｇから表題の化合物の粗生成物を１９２ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例３２７（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３３０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートの粗生成物１９２ｍｇから表題の化合物を５８ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（ピリミジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

２－（トリブチルスタンニル）フランに代えて２－（トリブチルスタンニル）ピリミジンを用いた以外は実施例６（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３３０（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を１５ｍｇ得た。

（ｅ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（ピリミジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３３０（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（ピリミジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１４ｍｇから表題の化合物を７．６ｍｇ得た。

【０４５８】

（実施例３３１）

１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（イソチアゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジ

フルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３３０（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－ブロモ－４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２９９ｍｇから表題の化合物の粗生成物を３６１ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（イソチアゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

２－ブロモ－５－フルオロピリジンに代えて３－ブロモ－イソチアゾールを用いた以外は、実施例１０（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３３１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートの粗生成物４２ｍｇから、表題の化合物を１２ｍｇ得た。

（ｃ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（イソチアゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３３１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（イソチアゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１２ｍｇから表題の化合物を５．０ｍｇ得た。

【０４５９】

（実施例３３２）

１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例１０（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３３１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートの粗生成物４０ｍｇから、表題の化合物を１１ｍｇ得た。

（ｂ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３３２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（５－フルオロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１０ｍｇから表題の化合物を８．３ｍｇ得た。

【０４６０】

（実施例３３３）

１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（３－メチル－１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（３－メチル－１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

２－ブロモ－５－フルオロピリジンに代えて５－ブロモ－３－メチル－１，２，４－チアジアゾールを用いた以外は、実施例１０（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３３１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートの粗生成物３６ｍｇから、表題の化合物を１７ｍｇ得た。

（ｂ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（３－メチル－１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３３３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（３－メチル－１，２，４－チアジアゾール－５－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート１６ｍｇから表題の化合物を７．０ｍｇ得た。

【０４６１】

（実施例３３４）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（（トリフルオロメチル）スルホニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例８５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２．０３ｇから、表題の化合物を２．２６ｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（トリフルオロメチル）スルホニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５４．７ｍｇをトルエン（２．５ｍＬ）に溶解し、ナトリウム　トリフルオロメタンスルフィネート（３１．２ｍｇ，２当量）、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（０）（４．６ｍｇ，０．０５当量）、２－ジ（ｔｅｒｔ－ブチル）ホスフィノ－２’，４’，６’－トリイソプロピル－３－メトキシ－６－メチルビフェニル（５．６ｍｇ，０．１２当量）及びトリス［２－（２－メトキシエトキシ）エチル］アミン（３μＬ，０．１当量）を加え、マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製）にて１５０℃で１時間撹拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液及び酢酸エチルを加え、セライト濾過を行った後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を１９．７ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チア

ゾール－２－イル）－４－（（トリフルオロメチル）スルホニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、３３４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（トリフルオロメチル）スルホニル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１９．７ｍｇから表題の化合物を１２．２ｍｇ得た。

【０４６２】

（実施例３３５）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボニトリル

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－シアノ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５４．６ｍｇをＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１ｍＬ）に溶解し、シアン化亜鉛（２３．５ｍｇ，２当量）及びテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）（１１．６ｍｇ，０．１当量）を加え、マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製）にて１３０℃で３０分間攪拌した。反応液に蒸留水及び酢酸エチルを加え、セライト濾過を行った後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を２８．８ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボニトリル

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３３５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－シアノ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２８．８ｍｇから表題の化合物を２０．７ｍｇ得た。

【０４６３】

（実施例３３６）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ベンジルブロミドに代えて２－クロロ－５－トリフルオロメチルピリジンを用い、９０℃で攪拌した以外は参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２１ｍｇから表題の化合物を２５ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３３６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２４ｍｇから表題の化合物を１９ｍｇ得た。

【０４６４】
（実施例３３７）
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピリジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ピリジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
ベンジルブロミドに代えて２－フルオロピリジンを用い、９０℃で２．５時間、１００℃で３日間、さらにマイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製）を用いて１２０℃にて１時間撹拌した以外は参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２１ｍｇから表題の化合物の粗生成物を１８ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピリジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３３７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ピリジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物１６ｍｇから表題の化合物を３．８ｍｇ得た。
【０４６５】
（実施例３３８）
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピリミジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ピリミジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
ベンジルブロミドに代えて２－ブロモピリミジンを用い、９０℃で撹拌した以外は参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピリミジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３３８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ピリミジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１１ｍｇから表題の化合物を７．１ｍｇ得た。
【０４６６】
（実施例３３９）
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピラジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ピラジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
ベンジルブロミドに代えて２－ヨードピラジンを用い、９０℃で１．５時間、１１５℃で３時間撹拌した以外は、参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２２ｍｇから表題の化合物を２４ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピラ

ジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３３９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ピラジン－２－イルオキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２４ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。
【０４６７】
（実施例３４０）
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（６－メチル－４－（トリフルオロメチル）ピリダジン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（６－メチル－４－（トリフルオロメチル）ピリダジン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
ベンジルブロミドに代えて３－クロロ－６－メチル－４－（トリフルオロメチル）ピリダジンを用い９０℃で攪拌した以外は、参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２１ｍｇから表題の化合物を１７ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（６－メチル－４－（トリフルオロメチル）ピリダジン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３４０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（６－メチル－４－（トリフルオロメチル）ピリダジン－３－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１６ｍｇから表題の化合物を６．８ｍｇ得た。
【０４６８】
（実施例３４１）
（６－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）メタノール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（５－（メトキシカルボニル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
ベンジルブロミドに代えてメチル　６－クロロニコチネートを用い、９０℃で攪拌した以外は、参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１９ｍｇから表題の化合物を２６ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（５－（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２５０（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３４１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（５－（メトキシカルボニル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２６ｍｇから表題の化合物を１７ｍｇ得た。
（ｃ）（６－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）メタノール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３４１（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（５－（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１６ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。

【０４６９】

（実施例３４２）

（６－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－５－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル）メタノール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（５－（メトキシカルボニル）－３－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ベンジルブロミドに代えてメチル　６－クロロ－５－（トリフルオロメチル）ニコチネートを用い、９０℃で攪拌した以外は、参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を３９ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（５－（ヒドロキシメチル）－３－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２５０（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３４２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（５－（メトキシカルボニル）－３－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３９ｍｇから表題の化合物を１０ｍｇ得た。

（ｃ）（６－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－５－（トリフルオロメチル）ピリジン－３－イル）メタノール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３４２（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（５－（ヒドロキシメチル）－３－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート８．８ｍｇから表題の化合物を７．１ｍｇ得た。

【０４７０】

（実施例３４３）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（（５－（トリフルオロメトキシ）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（５－（トリフルオロメトキシ）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ベンジルブロミドに代えて２－クロロ－５－（トリフルオロメトキシ）ピリジンを用い９０℃で攪拌した以外は、参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２１ｍｇから表題の化合物を１８ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チア

ゾール－２－イル）－４－（（５－（トリフルオロメトキシ）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３４３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（５－（トリフルオロメトキシ）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１６ｍｇから表題の化合物を６．８ｍｇ得た。

【０４７１】

（実施例３４４）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－シクロプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－シクロプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５４．６ｍｇを１，４－ジオキサン（１ｍＬ）に溶解し、シクロプロピルボロン酸（１２．９ｍｇ，１．５当量）、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）（５．８ｍｇ，０．０５当量）及び２Ｍ炭酸ナトリウム水溶液（０．２ｍＬ）を加え、１００℃で４時間攪拌した。反応液に蒸留水及び酢酸エチルを加え、セライト濾過を行った後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を３８．５ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－シクロプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３４４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－シクロプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３８．５ｍｇから表題の化合物を７．８ｍｇ得た。

【０４７２】

（実施例３４５）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１０９．３ｍｇを１，４－ジオキサン（２ｍＬ）に溶解し、ナトリウム　チオメトキシド（２８．０ｍｇ，２当量）、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（０）（１８．３ｍｇ，０．１当量）及び４，５－ビス（ジフェニルホスフィノ）－９，９－ジメチルキサンテン（２３．１ｍｇ，０．２当量）を加え、マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製）にて１５０℃で１時間攪拌した。反応液に蒸留水及び酢酸エチルを加え、セライト濾過を行った後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝２：１）で精製して、表題の化合物を５８．１ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３４５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４４．５ｍｇから表題の化合物を２８．７ｍｇ得た。

【０４７３】

（実施例３４６）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３４５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５３．０ｍｇをクロロホルム（１ｍＬ）に溶解し、ｍＣＰＢＡ（２９．３ｍｇ，１当量）を加え、室温で１時間攪拌した。反応液に炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：メタノール＝９：１）で精製して、表題の化合物を５０．２ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３４６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（メチルスルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５０．２ｍｇから表題の化合物を２７．５ｍｇ得た。

【０４７４】

（実施例３４７）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｍＣＰＢＡを２当量用いた以外は実施例３４６（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３４５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（メチルチオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート７９．３ｍｇから、表題の化合物を７１．２ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３４７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（メチルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート７１．２ｍｇから表題の化合物を５４．９ｍｇ得た。

【０４７５】

（実施例３４８）

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）チオ）エタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－ヒドロキシエチル）チオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ナトリウム　チオメトキシドに代えて２－メルカプトエタノール及びトリエチルアミンを用いた以外は、実施例３４５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５４．６ｍｇから、表題の化合物を４９．５ｍｇ得た。

（ｂ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）チオ）エタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３４８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－ヒドロキシエチル）チオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３８．０ｍｇから表題の化合物を２４．０ｍｇ得た。

【０４７６】

（実施例３４９）

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）スルフィニル）エタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－ヒドロキシエチル）スルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３４６（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３４８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－ヒドロキシエチル）チオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４７．５ｍｇから表題の化合物を４３．７ｍｇ得た。

（ｂ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）スルフィニル）エタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３４９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－ヒドロキシエチル）スルフィニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４３．７ｍｇから表題の化合物を２５．８ｍｇ得た。

【０４７７】

（実施例３５０）

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）スルホニル）エタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－ヒドロキシエチル）スルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３４７（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３４８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－ヒドロキシエチル）チオ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５４．６ｍｇから表題の化合物を４２．８ｍｇ得た。

（ｂ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）スルホニル）エタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３５０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－ヒドロキシエチル）スルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプ

タン－６－カルボキシレート４２．８ｍｇから表題の化合物を２７．９ｍｇ得た。

【０４７８】

（実施例３５１）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（１，１－ジフルオロアリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（１，１－ジフルオロアリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１２４．３ｍｇをテトラヒドロフラン（３ｍＬ）に溶解し、３－ブロモ－３，３－ジフルオロプロペン（７１μＬ，１．５当量）、水素化ナトリウム（１８ｍｇ，１．５当量）、酢酸パラジウム（ＩＩ）（６．７ｍｇ，０．１当量）及びトリフェニルホスフィン（２６．９ｍｇ，０．４当量）を加え、室温で１時間攪拌した。反応液に蒸留水及び酢酸エチルを加え、セライト濾過を行った後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を１３２．７ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（１，１－ジフルオロアリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３５１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（１，１－ジフルオロアリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３０．０ｍｇから表題の化合物を１１．８ｍｇ得た。

【０４７９】

（実施例３５２）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（５－（メチルスルホニル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（５－（メチルスルホニル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ベンジルブロミドに代えて２－ブロモ－５－（メチルスルホニル）ピリジンを用い９０℃で攪拌した以外は、参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を２９ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（５－（メチルスルホニル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３５２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（５－（メチルスルホニル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２８ｍｇから表題の化合物を９．６ｍｇ得た。

【０４８０】

（実施例３５３）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサ

ミド
（ａ）２，４，６－トリクロロフェニル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート
実施例３３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１００ｍｇ及び２，４，６－トリクロロフェニル　ホルメート（８５ｍｇ，２当量）、酢酸パラジウム（ＩＩ）（３．５ｍｇ，０．０５当量）、４，５－ビス（ジフェニルホスフィノ）－９，９－ジメチルキサンテン（１２．１ｍｇ，０．１当量）をトルエン（２ｍＬ）に溶解し、トリエチルアミン（５１μＬ，２当量）を加え、マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製）にて１５０℃で１時間攪拌した。反応液に蒸留水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を蒸留水で洗浄した後、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：０～１：１）で精製して、表題の化合物を２８ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－メトキシエチル）カルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例３５３（ａ）で得られた２，４，６－トリクロロフェニル　２－（６－（ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート２８ｍｇをアセトニトリル（０．５ｍＬ）に溶解し、２－メトキシエタン－１－アミン（８μＬ，２当量）を加え、２時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び蒸留水を加え、有機層を減圧濃縮して、表題の化合物の粗生成物を２５ｍｇ得た。
（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３５３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－メトキシエチル）カルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物２３ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。
【０４８１】
（実施例３５４）
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－カルバモイル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
２－メトキシエタン－１－アミンに代えて７Ｎアンモニアのメタノール溶液を用いた以外は実施例３５３（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３５３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（２，４，６－トリクロロベンゾイル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物の粗生成物を２０ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３５４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－カルバモイル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物１９ｍｇから表題の化合物を７．７ｍｇ得た。

【０４８２】
（実施例３５５）
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－ヒドロキシエチル）カルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
２－メトキシエタン－１－アミンに代えて２－アミノエタン－１－オールを用いた以外は実施例３５３（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３５３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（２，４，６－トリクロロベンゾイル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物の粗生成物を１６ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３５５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－ヒドロキシエチル）カルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物１６ｍｇから表題の化合物を６．２ｍｇ得た。
【０４８３】
（実施例３５６）
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－ヒドロキシエチル）（メチル）カルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
２－メトキシエタン－１－アミンに代えて２－（メチルアミノ）エタン－１－オールを用いた以外は実施例３５３（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３５３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（２，４，６－トリクロロベンゾイル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物の粗生成物を１６ｍｇ得た。
（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３５６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（２－ヒドロキシエチル）（メチル）カルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物１６ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。
【０４８４】
（実施例３５７）
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－シクロプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（シクロプロピルカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－メトキシエタン－１－アミンに代えてシクロプロパンアミンを用いた以外は実施例３５３（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３５３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（２，４，６－トリクロロベンゾイル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物の粗生成物を２２ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－シクロプロピル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３５７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（シクロプロピルカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物２０ｍｇから表題の化合物を４．３ｍｇ得た。

【０４８５】

（実施例３５８）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－エチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（エチルカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－メトキシエタン－１－アミンに代えてエタンアミンを用いた以外は実施例３５３（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３５３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（２，４，６－トリクロロベンゾイル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物の粗生成物を２２ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－エチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３５８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（エチルカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物２１ｍｇから表題の化合物を６．４ｍｇ得た。

【０４８６】

（実施例３５９）

（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（モルホリノ）メタノン

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（モルホリン－４－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－メトキシエタン－１－アミンに代えてモルホリンを用いた以外は実施例３５３（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３５３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（２，４，６－トリクロロベンゾイル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１６ｍｇから表題の化合物の粗生成物を３８ｍｇ得た。

（ｂ）（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（モルホリノ）メタノン

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３５９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（モルホリン－４－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物３８ｍｇから表題の化合物を９．９ｍｇ得た。

【０４８７】

（実施例３６０）

（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（ピロリジン－１－イル）メタノン

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ピロリジン－１－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－メトキシエタン－１－アミンに代えてピロリジンを用いた以外は実施例３５３（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３５３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（２，４，６－トリクロロベンゾイル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１９ｍｇから表題の化合物の粗生成物を２２ｍｇ得た。

（ｂ）（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）（ピロリジン－１－イル）メタノン

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３６０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ピロリジン－１－カルボニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物２２ｍｇから表題の化合物を９．５ｍｇ得た。

【０４８８】

（実施例３６１）

Ｎ－ベンジル－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－メトキシエタン－１－アミンに代えてフェニルメタンアミンを用いた以外は実施例３５３（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３５３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（２，４，６－トリクロロベンゾイル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１９ｍｇから表題の化合物の粗生成物を２６ｍｇ得た。

（ｂ）Ｎ－ベンジル－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３６１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物２６ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

【０４８９】

（実施例３６２）

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－３－メチルブタン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－３－メチルブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

０．９５Ｍメチルマグネシウムブロミドのテトラヒドロフラン溶液に代えて、３Ｍイソプロピルマグネシウムクロリドのジエチルエーテル溶液（２０当量）を用いた以外は、実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２００ｍｇから表題の化合物を１５０ｍ

ｇ得た。
（ｂ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－３－メチルブタン－２－オール
実施例３１５（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３６２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－３－メチルブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１５０ｍｇから表題の化合物を９０ｍｇ得た。
【０４９０】
（実施例３６３）
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（５－クロロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（５－クロロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
（５－フルオロピリジン－２－イル）ボロン酸に代えて（５－クロロピリジン－２－イル）ボロン酸を、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）に代えて酢酸パラジウム（ＩＩ）を用い、塩化銅（Ｉ）（１当量）及び１，１’－ビス（ジフェニルホスフィノ）フェロセン（０．１当量）を加えた以外は、実施例３１９（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１ｇから表題の化合物を５００ｍｇ得た。
（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（５－クロロピリジン－２－イル）－４－ヒドロキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例３３０（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３６３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（５－クロロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１８０ｍｇから表題の化合物の粗生成物を２００ｍｇ得た。
（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（５－クロロピリジン－２－イル）－４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３６３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（５－クロロピリジン－２－イル）－４－ヒドロキシベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物２００ｍｇから表題の化合物を４５ｍｇ得た。
（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（５－クロロピリジン－２－イル）－４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
０．９５Ｍメチルマグネシウムブロミドのテトラヒドロフラン溶液に代えて、３Ｍメチルマグネシウムブロミドのジエチルエーテル溶液を用いた以外は、実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３６３（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（５－クロロピリジン－２－イル）－４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４５ｍｇから表題の化合物を２０ｍｇ得た。
（ｅ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（５－クロロピリジン－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例３１５（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３６３（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（５－クロロピリジン－２－イル）－４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を８ｍｇ得た。

【０４９１】

（実施例３６４）

３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロ－２－メチルプロパン－１，２－ジオール（光学活性体）

実施例３２６（ｂ）で得られたラセミ体の３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロ－２－メチルプロパン－１，２－ジオール１０９．０ｍｇをＹＭＣ社製Ｍｕｌｔｉｐｌｅプレパラティブ ＨＰＬＣ（ＬＣ－ｆｏｒｔｅ／Ｒ）（使用カラム：ＤＡＩＣＥＬ　ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＩＣ（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２ｃｍ，カラム長：２５ｃｍ），展開溶媒、ヘキサン：イソプロピルアルコール：ジエチルアミン＝５０：５０：０．１，流速１９．８ｍＬ／ｍｉｎ，検出：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製し、保持時間が短いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を２６．８ｍｇ得た。

【０４９２】

（実施例３６５）

３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロ－２－メチルプロパン－１，２－ジオール（光学活性体、実施例３６４の鏡像異性体）

実施例３６４で精製した保持時間が長いピークのフラクションを濃縮して表題の化合物を２７．３ｍｇ得た。

【０４９３】

（実施例３６６）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボン酸

実施例１１３で得られたエチル　２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキシレート１６ｍｇと水酸化リチウム・一水和物（１７ｍｇ，１０当量）をテトラヒドロフラン（０．２ｍＬ）及び蒸留水（０．２ｍＬ）に溶解し、室温で４日間攪拌した。反応液を減圧濃縮し得られた残渣をギルソン社製プレパラティブＨＰＬＣ（使用カラム：Ｓｅｐａｘ　ＧＰ－Ｃ１８（粒子径：５μｍ，カラム径：φ２．１２ｃｍ，カラム長：１０ｃｍ），展開溶媒、水：アセトニトリル＝９０：１０～１０：９０，流速１５ｍＬ／ｍｉｎ、検出波長：ＵＶ２５４ｎｍ）で精製することにより、表題の化合物を１４ｍｇ得た。

【０４９４】

（実施例３６７）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ヒドロキシカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－メトキシエタン－１－アミンに代えてヒドロキシルアミン・一水和物を用い、さらにトリエチルアミン（２当量）を加えた以外は実施例３５３（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３５３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（２，４，６－トリクロロベンゾイル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－

２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物の粗生成物を２０ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－カルボキサミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３６７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ヒドロキシカルバモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物２０ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

【０４９５】

（実施例３６８）

３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール

実施例１９５で得られた２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール２０ｍｇをクロロホルム（０．５ｍＬ）に溶解し、ｍＣＰＢＡ（約３０％含水）（１７．１ｍｇ，１．５当量）を加え、室温で１．５時間攪拌した後、さらにｍＣＰＢＡ（約３０％含水）（１６．５ｍｇ，１．５当量）を加え、室温で１．５時間攪拌した。反応液にメタノール（０．５ｍＬ）及び炭酸カリウム（３６ｍｇ，６当量）を加え、さらに一晩攪拌した。反応液に蒸留水及びクロロホルムを加えた後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：メタノール＝９：１）で精製して、表題の化合物を９．７ｍｇ得た。

【０４９６】

（実施例３６９）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－モルホリノ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－モルホリノ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２８ｍｇ、炭酸セシウム（２８ｍｇ，１．５当量）、酢酸パラジウム（ＩＩ）（２．０ｍｇ，０．１当量）、２，２’－ビス（ジフェニルホスファニル）－１，１’－ビナフタレン（４．１ｍｇ，０．１当量）をトルエン（０．５ｍＬ）に溶解し、モルホリン（６μＬ，１．２当量）を加え、一晩加熱還流した。反応液をセライトで濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：０～１：１）で精製して、表題の化合物を１０ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－モルホリノ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３６９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－モルホリノ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物１０ｍｇから表題の化合物を６．０ｍｇ得た。

【０４９７】

（実施例３７０）

３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロプロパン－１，２－ジオール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２，３－ジヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３５１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（１，１－ジフルオロアリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２４．５ｍｇをアセトン－水（１ｍＬ）に溶解し、４－メチルモルホリン　Ｎ－オキシド（８．８ｍｇ，１．５当量）、四酸化オスミウム（４％水溶液）（２５μＬ，０．０５当量）を加え、室温で２４時間攪拌した。反応液に蒸留水及び酢酸エチルを加え、セライト濾過を行った後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：４）で精製して、表題の化合物を１９．４ｍｇ得た。

（ｂ）３－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－３，３－ジフルオロプロパン－１，２－ジオール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３７０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２，３－ジヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２２．８ｍｇから表題の化合物を１６．４ｍｇ得た。

【０４９８】

（実施例３７１）

３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール

実施例２４８で得られた１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール２１１．２ｍｇをクロロホルム（５ｍＬ）に溶解し、ｍＣＰＢＡ（約３０％含水）（１８４．９ｍｇ，１．５当量）を加え、室温で１時間攪拌した後、反応液にメタノール（５ｍＬ）及び炭酸カリウム（２０７．３ｍｇ，３当量）を加え、さらに１時間攪拌した。反応液に蒸留水及びクロロホルムを加えた後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：メタノール＝９：１）で精製して、表題の化合物を８３．３ｍｇ得た。

【０４９９】

（実施例３７２）

３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール（光学活性体）

実施例３７１と同様の方法を用いて、実施例２５１で得られた１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール（光学活性体）４０．８ｍｇから表題の化合物を１３．５ｍｇ得た。

【０５００】

（実施例３７３）

３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール（実施例３７２の鏡像異性体）

実施例３７１と同様の方法を用いて、実施例２５２で得られた１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベ

ンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２－オール（光学活性体、実施例２５１の鏡像異性体）４０．８ｍｇから表題の化合物を１６．９ｍｇ得た。

【０５０１】

（実施例３７４）

３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール

実施例３７１と同様の方法を用いて、実施例２４９で得られた２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール３９．４ｍｇから表題の化合物を９．３ｍｇ得た。

【０５０２】

（実施例３７５）

３－（５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール

実施例３７１と同様の方法を用いて、実施例１で得られた２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール４３．０ｍｇから表題の化合物を１６．９ｍｇ得た。

【０５０３】

（実施例３７６）

（２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）メタノール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（３－（メトキシカルボニル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ベンジルブロミドに代えてメチル　２－クロロニコチネートを用い、１２０℃で攪拌した以外は、参考例２３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５１ｍｇから表題の化合物を２６ｍｇ得た。

（ｂ）メチル　２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）ニコチネート

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３７６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（３－（メトキシカルボニル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１８ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

（ｃ）（２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）メタノール

実施例２５０（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３７６（ｂ）で得られたメチル　２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）ニコチネート１１ｍｇから表題の化合物を４．６ｍｇ得た。

【０５０４】

（実施例３７７）
１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロプロパン－２，２－ジオール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例２５０（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２，２－ジヒドロキシプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３０．０ｍｇから表題の化合物を１６．１ｍｇ得た。

【０５０５】
（実施例３７８）
３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール（光学活性体）
実施例３７１と同様の方法を用いて、実施例１１８で得られた１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（光学活性体）４１．０ｍｇから表題の化合物を１６．４ｍｇ得た。

【０５０６】
（実施例３７９）
３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（２，２，２－トリフルオロ－１－ヒドロキシエチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール（実施例３７８の鏡像異性体）
実施例３７１と同様の方法を用いて、実施例１１９で得られた１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）－２，２，２－トリフルオロエタン－１－オール（光学活性体、実施例１１８の鏡像異性体）４１．０ｍｇから表題の化合物を１５．７ｍｇ得た。

【０５０７】
（実施例３８０）
３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－オール
実施例３７１と同様の方法を用いて、実施例２９で得られた２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール２０ｍｇから表題の化合物を４．４ｍｇ得た。

【０５０８】
（実施例３８１）
３－（５－（２－ヒドロキシプロパン－２－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール
実施例３７１と同様の方法を用いて、実施例１７７で得られた２－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）プロパン－２－オール２１ｍｇから表題の化合物を６．０ｍｇ得た。

【０５０９】
（実施例３８２）
２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾー

ル－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

モルホリンに代えてシクロプロパンアミンを用い、酢酸パラジウム（ＩＩ）を０．２当量用い、マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製）にて１２０℃で１時間撹拌した以外は実施例３６９（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を２３ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３８２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから表題の化合物を８．８ｍｇ得た。

【０５１０】

（実施例３８３）

３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール

実施例３７１と同様の方法を用いて、実施例２０２で得られた１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール２０ｍｇから表題の化合物を６．２ｍｇ得た。

【０５１１】

（実施例３８４）

３－（５－（１－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－オール

実施例３７１と同様の方法を用いて、実施例１８１で得られた１－（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－４－（トリフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）エタン－１－オール２０ｍｇから表題の化合物を６．９ｍｇ得た。

【０５１２】

（実施例３８５）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（クロロスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５６６．８ｍｇを１，４－ジオキサン（１０ｍＬ）に溶解し、トリイソプロピルシランチオール（４４４μＬ，２当量）、トリエチルアミン（２８９μＬ，２当量）、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（０）（９５．０ｍｇ，０．１当量）及び４，５－ビス（ジフェニルホスフィノ）－９，９－ジメチルキサンテン（１２０．０ｍｇ，０．２当量）を加え、マイクロウェーブ反応装置（Ｂｉｏｔａｇｅ社製）にて１５０℃で１時間撹拌した。反応液に蒸留水及び酢酸エチルを加え、セライト濾過を行った後、有機層を無水

硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をアセトニトリル（１０ｍＬ）に溶解し、１Ｍ塩酸水溶液（２ｍＬ）及びＮ－クロロスクシンイミド（５５３．９ｍｇ，４当量）を加え、室温で１時間攪拌した。反応液に炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出後、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物を３６４．２ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）スルファモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３８５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（クロロスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２４．８ｍｇをアセトニトリル（１ｍＬ）に溶解し、２－アミノエタノール（９μＬ，３当量）を加え、室温で１時間攪拌した。反応液に蒸留水及び酢酸エチルを加え、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、これを濾過した。濾液を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：４）で精製して、表題の化合物を２６．１ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３８５（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）スルファモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２６．１ｍｇから表題の化合物を１３．８ｍｇ得た。

【０５１３】

（実施例３８６）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（Ｎ－メチルスルファモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－アミノエタノールに代えて４０％メチルアミンのメタノール溶液を用いた以外は、実施例３８５（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３８５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（クロロスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２４．８ｍｇから表題の化合物を２４．６ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３８６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（Ｎ－メチルスルファモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２４．６ｍｇから表題の化合物を１７．１ｍｇ得た。

【０５１４】

（実施例３８７）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（Ｎ－（２－メトキシエチル）スルファモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－アミノエタノールに代えて２－メトキシエチルアミンを用いた以外は、実施例３８５（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３８５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（クロロスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２４．８ｍｇから表題の化合物を２６．８ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３８７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（Ｎ－（２－メトキシエチル）スルファモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２６．８ｍｇから表題の化合物を１９．８ｍｇ得た。

【０５１５】

（実施例３８８）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（Ｎ，Ｎ－ジメチルスルファモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－アミノエタノールに代えてジメチルアミン塩酸塩を用い、トリエチルアミンを１．５当量加えた以外は、実施例３８５（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３８５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（クロロスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２４．８ｍｇから表題の化合物を２５．３ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ，Ｎ－ジメチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３８８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（Ｎ，Ｎ－ジメチルスルファモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２５．３ｍｇから表題の化合物を１５．９ｍｇ得た。

【０５１６】

（実施例３８９）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルスルファモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－アミノエタノールに代えて２－（メチルアミノ）エタノールを用いた以外は、実施例３８５（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３８５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（クロロスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２４．８ｍｇから表題の化合物を２５．３ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３８９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルスルファモイル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２５．３ｍｇから表題の化合物を１９

．５ｍｇ得た。

【０５１７】

（実施例３９０）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピロリジン－１－イルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ピロリジン－１－イルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－アミノエタノールに代えてピロリジンを用いた以外は、実施例３８５（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３８５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（クロロスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２４．８ｍｇから表題の化合物を２６．６ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピロリジン－１－イルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３９０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ピロリジン－１－イルスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２６．６ｍｇから表題の化合物を１８．８ｍｇ得た。

【０５１８】

（実施例３９１）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（モルホリノスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（モルホリノスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－アミノエタノールに代えてモルホリンを用いた以外は、実施例３８５（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３８５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（クロロスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２４．８ｍｇから表題の化合物を２７．４ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（モルホリノスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３９１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（モルホリノスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２７．４ｍｇから表題の化合物を２０．６ｍｇ得た。

【０５１９】

（実施例３９２）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１，１－ジフルオロ－２－メトキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－メトキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２４９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３０ｍｇから表題の化合物を２８ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１，１－ジフルオロ－２－メトキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３９２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－メトキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２６ｍｇから表題の化合物を１９ｍｇ得た。

【０５２０】

（実施例３９３）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１，１－ジフルオロ－２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例１０２（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｅ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３１ｍｇから表題の化合物を３０ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１，１－ジフルオロ－２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３９３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－メトキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２９ｍｇから表題の化合物を９．５ｍｇ得た。

【０５２１】

（実施例３９４）

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

（５－クロロピリジン－２－イル）ボロン酸に代えて１－メチル－３－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－１Ｈ－ピラゾールを用いた以外は、実施例３６３（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－ブロモベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を８０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３１５（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３９４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンジルオキシ）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート８０ｍｇから表題の化合物を５０ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソ

エトキシ）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３９４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５０ｍｇから表題の化合物を３０ｍｇ得た。

（ｄ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３９４（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１２０ｍｇから表題の化合物を１２０ｍｇ得た。

（ｅ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例３１５（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３９４（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（１－メチル－１Ｈ－ピラゾール－３－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１２０ｍｇから表題の化合物を５０ｍｇ得た。

【０５２２】

（実施例３９５）

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロブタン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

０．９５Ｍメチルマグネシウムブロミドのテトラヒドロフラン溶液に代えて、３Ｍエチルマグネシウムブロミドのジエチルエーテル溶液（２０当量）を用いた以外は、実施例２４８（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を９０ｍｇ得た。

（ｂ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロブタン－２－オール

実施例３１５（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３９５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシブトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート９０ｍｇから表題の化合物を３０ｍｇ得た。

【０５２３】

（実施例３９６）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－スルファモイル－７－（チアゾール－２－イル）ベ

ンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－アミノエタノールに代えて２８％アンモニア水を用いた以外は、実施例３８５（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３８５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（クロロスルホニル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２３．４ｍｇから表題の化合物を２０．１ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－スルホンアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３９６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－スルファモイル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０．１ｍｇから表題の化合物を１５．９ｍｇ得た。

【０５２４】

（実施例３９７）

１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）ピペリジン－４－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（４－ヒドロキシピペリジン－１－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

モルホリンに代えて４－ヒドロキシピペリジンを用いた以外は、実施例３６９（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５４．７ｍｇから表題の化合物を２０．７ｍｇ得た。

（ｂ）１－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）ピペリジン－４－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３９７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（４－ヒドロキシピペリジン－１－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０．７ｍｇから表題の化合物を９．９ｍｇ得た。

【０５２５】

（実施例３９８）

４－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）チオモルホリン　１，１－ジオキシド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジオキシドチオモルホリノ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

モルホリンに代えてチオモルホリン　１，１－ジオキシドを用いた以外は、実施例３６９（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート８２．０ｍｇから表題の化合物を６８．２ｍｇ得た。

（ｂ）４－（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）チオモルホリン　１，１－ジオキシド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３９８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジオキシドチオモルホリノ）－７－（チアゾール－２－イル）

ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６８．２ｍｇから表題の化合物を４０．４ｍｇ得た。

【０５２６】

（実施例３９９）

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－ブロモ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ブロモ－４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート９９ｍｇをテトラヒドロフラン（２ｍＬ）に溶解し、Ｎ－ブロモスクシンイミド（５１ｍｇ，１．１当量）を加え室温で３．５時間撹拌した。反応液に蒸留水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝１：０～１：４）で精製して、表題の化合物を６０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ブロモ－４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例３９９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ブロモ－４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６０ｍｇから表題の化合物を４５ｍｇ得た。

（ｃ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ブロモ－４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３２７（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例３９９（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ブロモ－４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート４５ｍｇから表題の化合物を３６ｍｇ得た。

（ｄ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－ブロモ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例３９９（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ブロモ－４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１２ｍｇから表題の化合物を７．７ｍｇ得た。

【０５２７】

（実施例４００）

１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

Ｎ－ブロモスクシンイミドの代わりにＮ－クロロスクシンイミドを用い、ｐ－トルエンスルホン酸　一水和物を０．１当量加えた以外は、実施例３９９（ａ）と同様の方法を用

いて、実施例２４８（ｅ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６０ｍｇから表題の化合物を５８ｍｇ得た。

（ｂ）１－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４００（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５７ｍｇから表題の化合物を３７ｍｇ得た。

【０５２８】

（実施例４０１）

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例４００（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６０ｍｇから表題の化合物を６４ｍｇ得た。

（ｂ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－クロロ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４０１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６２ｍｇから表題の化合物を２５ｍｇ得た。

【０５２９】

（実施例４０２）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１，１－ジフルオロプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

エタノール及び酢酸エチルに代えてメタノールを用い、パラジウム／炭素を１０重量％用いた以外は、実施例３１５（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例３５１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（１，１－ジフルオロアリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから、表題の化合物の粗生成物を１７ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（１，１－ジフルオロプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４０２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－

６－カルボキシレートの粗生成物１６ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

【０５３０】

（実施例４０３）

4－（ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イルジフルオロメトキシ）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イルジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル　４－メチルベンゼンスルホネートに代えて２－（ブロモジフルオロメチル）ベンゾ［ｄ］オキサゾールを用いた以外は実施例２６２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｃ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３１ｍｇから、表題の化合物を２３ｍｇ得た。

（ｂ）4－（ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イルジフルオロメトキシ）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４０３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イルジフルオロメトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２３ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

【０５３１】

（実施例４０４）

２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）と同様の方法を用いて、実施例８１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート７２ｍｇから、表題の化合物を７７ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート

実施例２５０（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４０４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４９ｍｇから、表題の化合物を３４ｍｇ得た。

（ｃ）２－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４０４（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート３２ｍｇから表題の化合物を２１ｍｇ得た。

【０５３２】
（実施例４０５）
１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート
実施例３２７（ｅ）と同様の方法を用いて、実施例４０４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート４４ｍｇから、表題の化合物を２５ｍｇ得た。
（ｂ）１－（（２－（３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－１，１－ジフルオロ－２－メチルプロパン－２－オール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４０５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－ヒドロキシ－２－メチルプロポキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレート２３ｍｇから表題の化合物を１４ｍｇ得た。
【０５３３】
（実施例４０６）
（Ｅ）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（１，１－ジフルオロ－３－（ピリジン－３－イル）アリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　（Ｅ）－３－（４－（（１，１－ジフルオロ－３－（ピリジン－３－イル）アリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（０）（２．０ｍｇ，０．０１５当量）、トリ－ｔｅｒｔ－ブチルホスホニウム　テトラフルオロボレート（）１．６ｍｇ，０．０３当量）を１，４－ジオキサン（１ｍＬ）に溶解し、実施例３５１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（（１，１－ジフルオロアリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５２ｍｇ、３－ブロモピリジン（９．９μＬ，１当量）及びＮ，Ｎ－ジシクロヘキシルメチルアミン（２４μＬ，１．１当量）を加え室温にて終夜攪拌した。４０℃で３時間、８０℃で３時間、１００℃で３日間攪拌した後、さらに２日間加熱還流した。反応液に蒸留水及び酢酸エチルを加えた後、有機層を減圧濃縮して得られた残渣をプレパラティブＴＬＣ（展開溶媒、ヘキサン：酢酸エチル＝１：１）で精製して、表題の化合物の粗生成物を４６ｍｇ得た。
（ｂ）（Ｅ）－２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（（１，１－ジフルオロ－３－（ピリジン－３－イル）アリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４０６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　（Ｅ）－３－（４－（（１，１－ジフルオロ－３－（ピリジン－３－イル）アリル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物４６ｍｇから表題の化合物を３．７ｍｇ得た。
【０５３４】

（実施例４０７）

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルアセトアミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－（（２－ヒドロキシエチル）（メチル）アミノ）－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例２４８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２１ｍｇをメタノール（０．４ｍＬ）に溶解し、２－（メチルアミノ）エタン－１－オール（３０μＬ，１０当量）を加え、室温にて１．５時間攪拌した。反応液に蒸留水及び酢酸エチルを加え、有機層を減圧濃縮して、表題の化合物の粗生成物を２２ｍｇ得た。

（ｂ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）－Ｎ－メチルアセトアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４０７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－（（２－ヒドロキシエチル）（メチル）アミノ）－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物２２ｍｇから表題の化合物を６．５ｍｇ得た。

【０５３５】

（実施例４０８）

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－（ジメチルアミノ）－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－（メチルアミノ）エタン－１－オールに代えてジメチルアミンの２．０Ｍテトラヒドロフラン溶液を用い、メタノールに代えてテトラヒドロフランを用いた以外は実施例４０７（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから、表題の化合物の粗生成物を２４ｍｇ得た。

（ｂ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－Ｎ，Ｎ－ジメチルアセトアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４０８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－（ジメチルアミノ）－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物２２ｍｇから表題の化合物を１７ｍｇ得た。

【０５３６】

（実施例４０９）

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフル

オロ－１－モルホリノエタン－１－オン
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－モルホリノ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
２－（メチルアミノ）エタン－１－オールに代えてモルホリンを用い、メタノールに代えてアセトニトリルを用いた以外は実施例４０７（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１９ｍｇから、表題の化合物を１４ｍｇ得た。
（ｂ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－１－モルホリノエタン－１－オン
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４０９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－モルホリノ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１４ｍｇから表題の化合物を５．４ｍｇ得た。
【０５３７】
（実施例４１０）
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロアセトアミド
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－アミノ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
２－（メチルアミノ）エタン－１－オールに代えて７Ｎアンモニアのメタノール溶液を用いた以外は実施例４０７（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから、表題の化合物の粗生成物を２２ｍｇ得た。
（ｂ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロアセトアミド
実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４１０（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－アミノ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物２０ｍｇから表題の化合物を７．６ｍｇ得た。
【０５３８】
（実施例４１１）
２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アセトアミド
（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－（（２－ヒドロキシエチル）アミノ）－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート
モルホリンに代えて２－アミノエタン－１－オールを用いた以外は実施例４０９（ａ）

と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２１ｍｇから、表題の化合物の粗生成物を２５ｍｇ得た。

（ｂ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－Ｎ－（２－ヒドロキシエチル）アセトアミド

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４１１（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－（（２－ヒドロキシエチル）アミノ）－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物２５ｍｇから表題の化合物を１２ｍｇ得た。

【０５３９】

（実施例４１２）

２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－１－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）エタン－１－オン

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

２－（メチルアミノ）エタン－１－オールに代えてアゼチジン－３－オール塩酸塩（２当量）を用い、トリエチルアミン（４当量）を加えた以外は実施例４０７（ａ）と同様の方法を用いて、実施例２４８（ｄ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（２－エトキシ－１，１－ジフルオロ－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２０ｍｇから、表題の化合物の粗生成物を２４ｍｇ得た。

（ｂ）２－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－４－イル）オキシ）－２，２－ジフルオロ－１－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）エタン－１－オン

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４１２（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（１，１－ジフルオロ－２－（３－ヒドロキシアゼチジン－１－イル）－２－オキソエトキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレートの粗生成物２４ｍｇから表題の化合物を１４ｍｇ得た。

【０５４０】

（実施例４１３）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ジイソプロピルエチルアミンに代えてトリエチルアミンを用い、反応溶媒としてジクロロメタン－テトラヒドロフラン（１：１）を用いた以外は、実施例２５６（ｂ）と同様の方法を用いて、実施例６４で得られた２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－オール４８０ｍｇから表題の化合物を５００ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－

３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル　４－メチルベンゼンスルホネートの代わりに２－クロロ－５－（トリフルオロメチル）ピリジンを用い、１１０℃で攪拌した以外は、実施例２６２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例４１３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を５０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４１３（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（（５－（トリフルオロメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５０ｍｇから表題の化合物を２５ｍｇ得た。

【０５４１】

（実施例４１４）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－シクロブチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－シクロブチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

シクロプロピルボロン酸の代わりにシクロブチルボロン酸を用いた以外は実施例３４４（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート５４．６ｍｇから表題の化合物を１９．９ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－シクロブチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４１４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－シクロブチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１９．９ｍｇから表題の化合物を１３．４ｍｇ得た。

【０５４２】

（実施例４１５）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピロリジン－１－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ピロリジン－１－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

モルホリンに代えてピロリジンを用いた以外は、実施例３６９（ａ）と同様の方法を用いて、実施例３３４（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－４－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート８２．０ｍｇから表題の化合物を１５．６ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－４－（ピロリジン－１－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４１５（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（４－（ピロリジン－１－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カル

ボキシレート１５．６ｍｇから表題の化合物を１２．４ｍｇ得た。

【０５４３】

（実施例４１６）

（６－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）メタノール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（（５－（メトキシカルボニル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル　４－メチルベンゼンスルホネートの代わりにメチル　６－クロロニコチネートを用い、１１０℃で攪拌した以外は、実施例２６２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例４１３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１５０ｍｇから表題の化合物を１００ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（（５－（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

参考例１７と同様の方法を用いて、実施例４１６（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（（５－（メトキシカルボニル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を６０ｍｇ得た。

（ｃ）（６－（（２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－イル）オキシ）ピリジン－３－イル）メタノール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４１６（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（（５－（ヒドロキシメチル）ピリジン－２－イル）オキシ）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート６０ｍｇから表題の化合物を１０ｍｇ得た。

【０５４４】

（実施例４１７）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボニトリル

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ジイソプロピルアミンの代わりトリエチルアミンを用いた以外は、実施例８５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例４１３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２５０ｍｇから表題の化合物を２７０ｍｇ得た。

（ｂ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－シアノ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

実施例３３５（ａ）と同様の方法を用いて、実施例４１７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を４０ｍｇ得た。

（ｃ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－５－カルボニトリル

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４１７（ｂ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－シアノ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート３５ｍｇから表題の化合物を１１ｍｇ得た。

【０５４５】

（実施例４１８）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（ピリジン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ピリジン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－クロロ－７－（４，４，５，５－テトラメチル－１，３，２－ジオキサボロラン－２－イル）－４－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，８－ジアザビシクロ［３．２．１］オクタン－８－カルボキシレートに代えてピリジン－３－イルボロン酸を、２－ブロモ－５－フルオロピリジンに代えて実施例４１７（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（７－（チアゾール－２－イル）－５－（（（トリフルオロメチル）スルホニル）オキシ）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート２７０ｍｇを用い、１２０℃で攪拌した以外は、実施例１０（ｂ）と同様の方法を用いて表題の化合物を８５ｍｇ得た。

（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－（ピリジン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４１８（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－（ピリジン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を３３ｍｇ得た。

【０５４６】

（実施例４１９）

２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－シクロブトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

（ａ）ｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－シクロブトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート

テトラヒドロ－２Ｈ－ピラン－３－イル　４－メチルベンゼンスルホネートの代わりにブロモシクロブタンを用い、６５℃で攪拌した以外は、実施例２６２（ａ）と同様の方法を用いて、実施例４１３（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－ヒドロキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート１００ｍｇから表題の化合物を９０ｍｇ得た。

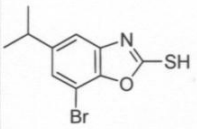
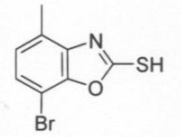
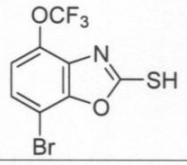
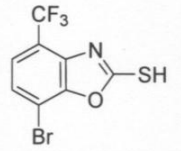
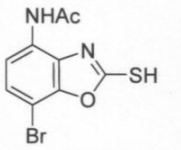
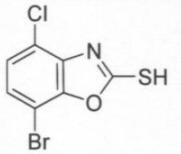
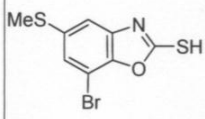
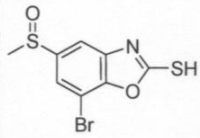
（ｂ）２－（３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－３－イル）－５－シクロブトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール

実施例１（ｃ）と同様の方法を用いて、実施例４１９（ａ）で得られたｔｅｒｔ－ブチル　３－（５－シクロブトキシ－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ［ｄ］オキサゾール－２－イル）－３，６－ジアザビシクロ［３．１．１］ヘプタン－６－カルボキシレート９０ｍｇから表題の化合物を２５ｍｇ得た。

【０５４７】

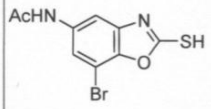
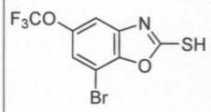
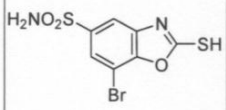
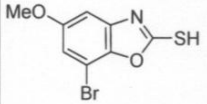
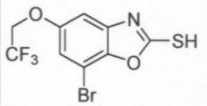
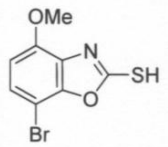
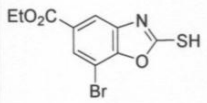
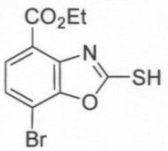
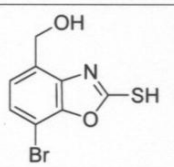
以下、表１～表３は参考例化合物、表４～表５６は実施例化合物である。さらに表中には、各化合物のＥＳＩ－ＭＳ及び^{1}Ｈ　ＮＭＲによる分析結果も示す。

【０５４８】
【表１】

参考例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR (400 MHz)、δ (ppm)	重溶媒
1		7－ブロモ－5－イソプロピルベンゾ[d]オキサゾール－２－チオール	272 $(M+H)^+$	1. 19(d, J=6. 8Hz, 6H), 2. 91－3. 02(m, 1H), 7. 05(d, J=1. 2Hz, 1H), 7. 34(d, J=1. 2Hz, 1H), 14. 08(brs, 1H)	DMSO-d_6
2		7－ブロモ－４－メチルベンゾ[d]オキサゾール－２－チオール	245 $(M+2H)^+$	2. 33(s, 3H), 7. 07(d, J=8. 4Hz, 1H), 7. 36(d, J=8. 4Hz, 1H), 14. 23(brs, 1H)	DMSO-d_6
3		7－ブロモ－４－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－２－チオール	312 $(M-H)^-$	7. 31(dq, J=9. 0, 1. 3Hz, 1H), 7. 54(d, J=9. 0Hz, 1H)	DMSO-d_6
4		7－ブロモ－４－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール－２－チオール	298 $(M+H)^+$	3. 7(brs, 1H), 7. 54(d, J=8. 8Hz, 1H), 7. 64(d, J=8. 8Hz, 1H)	DMSO-d_6
5		N－(7－ブロモ－２－メルカプトベンゾ[d]オキサゾール－４－イル)アセトアミド	275 $(M-H)^-$	2. 06(s, 3H), 7. 23(d, J=8. 8Hz, 1H), 7. 43(d, J=8. 8Hz, 1H), 9. 93(brs, 1H), 13. 6(brs, 1H)	DMSO-d_6
6		7－ブロモ－４－クロロベンゾ[d]オキサゾール－２－チオール	264 $(M+H)^+$	7. 34(d, J=8. 4Hz, 1H), 7. 48(d, J=8. 4Hz, 1H)	DMSO-d_6
7		7－ブロモ－５－(メチルチオ)ベンゾ[d]オキサゾール－２－チオール	274 $(M-H)^-$	2. 52(s, 3H), 7. 50(d, J=1. 2Hz, 1H), 7. 75(d, J=1. 2Hz, 1H), 14. 3(brs, 1H)	DMSO-d_6
8		7－ブロモ－５－(メチルスルフィニル)ベンゾ[d]オキサゾール－２－チオール	292 $(M+H)^+$	2. 80(s, 3H), 3. 41(brs, 1H), 7. 50(d, J=1. 2Hz, 1H), 7. 75(d, J=1. 2Hz, 1H)	DMSO-d_6

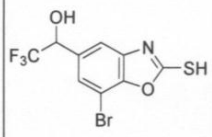
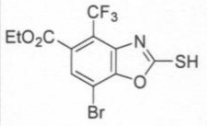
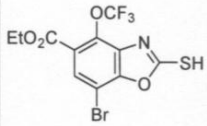
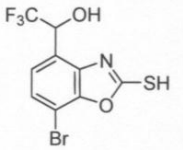
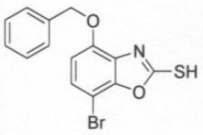
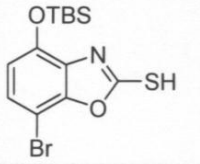
【０５４９】

【表２】

参考例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR (400 MHz)、δ (ppm)	重溶媒
9		Ｎ－（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ[d]オキサゾール－５－イル）アセトアミド	288 $(M+2H)^+$	2. 06(s, 3H), 7. 57(d, J＝2Hz, 1H), 7. 64(d, J＝2Hz, 1H), 10. 22(brs, 1H), 14. 02(brs, 1H)	DMSO-d_6
10		７－ブロモ－５－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－２－チオール	312 $(M-H)^-$	7. 28－7. 29(m, 1H), 7. 60－7. 61(m, 1H), 10. 22(brs, 1H), 14. 22(brs, 1H)	DMSO-d_6
11		７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ[d]オキサゾール－５－スルホンアミド	309 $(M+H)^+$	7. 62(d, J＝1. 6Hz, 1H), 7. 91(d, J＝1. 6Hz, 1H)	CD_3OD
12		７－ブロモ－５－メトキシベンゾ[d]オキサゾール－２－チオール	260 $(M+H)^+$	3. 79(s, 3H), 6. 76(d, J＝2. 4Hz, 1H), 7. 07(d, J＝2. 4Hz, 1H), 14. 08(brs, 1H)	DMSO-d_6
13		７－ブロモ－５－（２，２，２－トリフルオロエトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－２－チオール	328 $(M+H)^+$	4. 85(q, J＝9. 2Hz、2H), 6. 94(d, J＝2. 4Hz, 1H), 7. 23(d, J＝2. 4Hz, 1H), 14. 2(brs, 1H)	DMSO-d_6
14		７－ブロモ－４－メトキシベンゾ[d]オキサゾール－２－チオール	258 $(M-H)^-$	3. 90(s, 3H), 6. 97(d, J＝8. 8Hz, 1H), 7. 42(d, J＝8. 8Hz, 1H), 14. 3(brs, 1H)	DMSO-d_6
15		エチル　７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ[d]オキサゾール－５－カルボキシレート	302 $(M+H)^+$	1. 33(t, J＝7. 2Hz, 3H), 4. 36(q, J＝7. 2Hz, 2H), 7. 61(d, J＝1. 6Hz, 1H), 7. 96(d, J＝1. 6Hz, 1H)	DMSO-d_6
16		エチル７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ[d]オキサゾール－４－カルボキシレート	300 $(M-H)^-$	1. 35(t, J＝6. 8Hz, 3H), 4. 44(q, J＝6. 8Hz, 2H), 7. 59(d, J＝8. 4Hz, 1H), 7. 71(d, J＝8. 4Hz, 1H), 14. 03(brs, 1H)	DMSO-d_6
17		（７－ブロモ－２－メルカプトベンゾ[d]オキサゾール－４－イル）メタノール	258 $(M-H)^-$	4. 59(s, 2H), 5. 37(s, 1H), 7. 25(d, J＝8. 8Hz, 1H), 7. 45(d, J＝8. 8Hz, 1H), 14. 16(brs, 1H)	DMSO-d_6

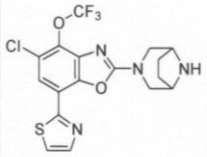
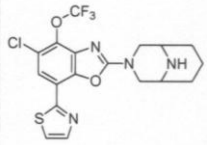
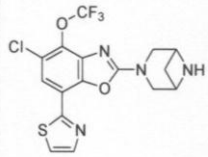
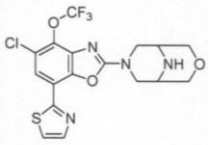
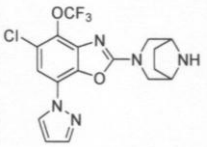
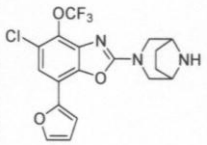
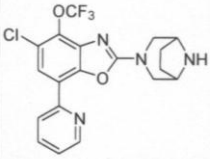
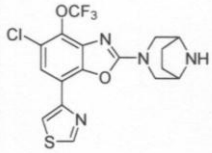
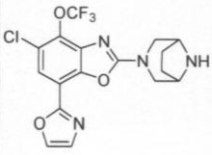
【０５５０】

【表３】

参考例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR (400 MHz)、δ (ppm)	重溶媒
18		1－(7－ブロモ－2－メルカプトベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエタン－1－オール	328 $(M+H)^+$	5. 32－5. 37(m, 1H), 7. 13(brs, 1H), 7. 33(s, 1H), 7. 58(s, 1H), 14. 24(brs, 1H)	DMSO-d_6
19		エチル 7－ブロモ－2－メルカプト－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	368 $(M-H)^-$	1. 29(t, J=6. 8Hz, 3H), 4. 32(q, J=6. 8Hz, 2H), 7. 79(s, 1H)	DMSO-d_6
20		エチル 7－ブロモ－2－メルカプト－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	386 $(M+H)^+$	1. 31(t, J=6. 8Hz, 3H), 4. 34(q, J=6. 8Hz, 2H), 7. 90(s, 1H)	DMSO-d_6
21		1－(7－ブロモ－2－メルカプトベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエタン－1－オール	328 $(M+H)^+$	5. 46(q, J=6Hz, 1H), 7. 23(brs, 1H), 7. 40(d, J=8Hz, 1H), 7. 56(d, J=8Hz, 1H), 14. 3(brs, 1H)	DMSO-d_6
22		メチル 7－ブロモ－2－メルカプトベンゾ[d]オキサゾール－4－カルボキシレート	288 $(M+H)^+$	3. 9(s, 3H), 7. 59(d, J=8. 8Hz, 1H), 7. 71(d, J=8. 8Hz, 1H), 14. 02(brs, 1H)	$CDCl_3$
23		4－(ベンジルオキシ)－7－ブロモベンゾ[d]オキサゾール－2－チオール	336 $(M+H)^+$	5. 15(s, 2H), 6. 75(d, J=8. 9Hz, 1H), 7. 25－7. 27(m, 1H), 7. 37－7. 43(m, 5H), 9. 51(brs, 1H)	$CDCl_3$
24		7－ブロモ－4－((tert－ブチルジメチルシリル)オキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－2－チオール	358 $(M-H)^-$	0. 22(s, 6H), 0. 95(s, 9H), 6. 51(d, J=8. 8Hz, 1H), 7. 02(d, J=8. 8Hz, 1H)	$CDCl_3$

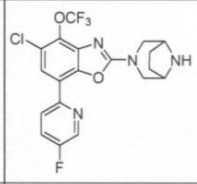
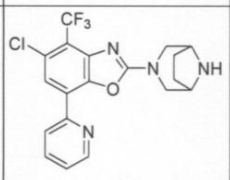
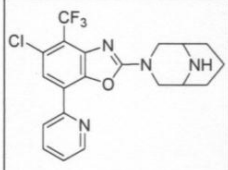
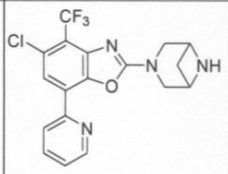
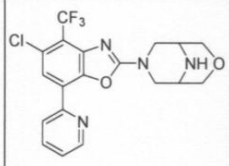
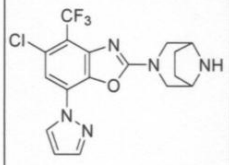
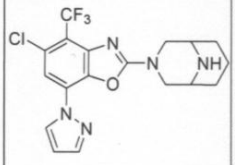
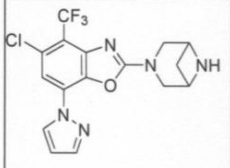
【０５５１】

【表４】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
1		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－クロロ－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	431 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.88 (s, 4H), 3.46 (dd, J=12.2, 1.7 Hz, 2H), 3.69 (s, 2H), 4.04 (dd, J=12.2, 1.7 Hz, 2H), 7.51 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.97 (dd, J=3.3, 0.55 Hz, 1H)	$CDCl_3$
2		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－5－クロロ－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	445 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.60–1.69 (m, 1H), 1.88–2.07 (m, 5H), 3.24–3.30 (m, 2H), 3.63 (dd, J=12.8, 3.9 Hz, 2H), 4.27 (d, J=12.8 Hz, 2H), 7.52 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
3		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－5－クロロ－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	417 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.87 (d, J=9.3 Hz, 1H), 3.92 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.96–4.07 (m, 4H), 7.52 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.99 (s, 1H)	$CDCl_3$
4		7－(5－クロロ－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－2－イル)－3－オキサ－7, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン	447 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 3.02 (s, 2H), 3.71 (d, J=13.0 Hz, 2H), 3.92 (dt, J=11.5, 2.5 Hz, 2H), 4.05 (d, J=11.5 Hz, 2H), 4.51 (d, J=13.0 Hz, 2H), 7.50 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
5		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－クロロ－7－(1H－ピラゾール－1－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	414 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.87 (d, J=2.1 Hz, 4H), 3.43 (dd, J=12.2, 2.1 Hz, 2H), 3.67 (s, 2H), 3.91–4.02 (m, 2H), 6.54 (dd, J=2.6, 1.8 Hz, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.77 (d, J=1.8 Hz, 1H), 8.15 (d, J=2.6 Hz, 1H)	$CDCl_3$
6		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－クロロ－7－(フラン－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	414 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.87 (d, J=2.0 Hz, 4H), 3.42 (dd, J=12.2, 2.0 Hz, 2H), 3.67 (s, 2H), 3.99 (dd, J=12.2, 2.0 Hz, 2H), 6.56 (dd, J=3.4, 1.8 Hz, 1H), 6.88 (dd, J=3.4, 0.7 Hz, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.55 (dd, J=1.8, 0.7 Hz, 1H)	$CDCl_3$
7		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－クロロ－7－(ピリジン－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	425 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.87 (d, J=2.0 Hz, 4H), 3.42 (dd, J=12.2, 2.0 Hz, 2H), 3.67 (s, 2H), 3.98 (dd, J=12.2, 2.0 Hz, 2H), 7.31 (ddd, J=7.5, 4.8, 1.1 Hz, 1H), 7.83 (dt, J=7.5, 1.8 Hz, 1H), 7.92–7.98 (m, 2H), 8.72–8.78 (m, 1H)	$CDCl_3$
8		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－クロロ－7－(チアゾール－4－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	431 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.88 (d, J=2.1 Hz, 4H), 3.45 (dd, J=12.2, 2.1 Hz, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.00 (dd, J=12.2, 2.1 Hz, 2H), 7.87 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 8.92 (d, J=2.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
9		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－クロロ－7－(オキサゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	415 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.87 (d, J=1.8 Hz, 4H), 3.43 (dd, J=12.4, 1.8 Hz, 2H), 3.66 (s, 2H), 4.05 (dd, J=12.4, 1.8 Hz, 2H), 7.34 (d, J=0.7 Hz, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.81 (d, J=0.7 Hz, 1H)	$CDCl_3$

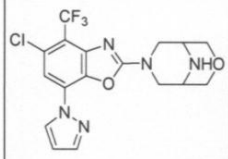
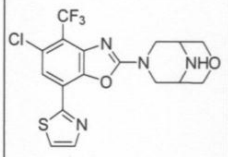
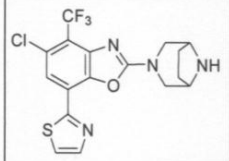
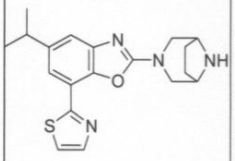
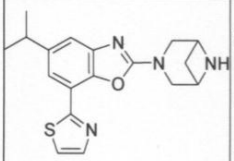
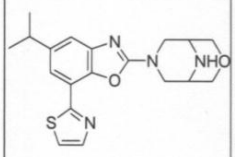
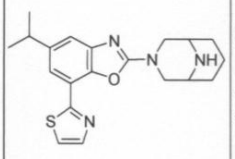
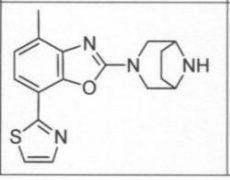
【０５５２】

【表５】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ（ppm）	重溶媒
10		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－クロロ－7－(5－フルオロピリジン－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	443 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.87 (d, J=1.7 Hz, 4H), 3.43 (dd, J=12.2, 1.7 Hz, 2H), 3.67 (s, 2H), 3.97 (dd, J=12.2, 1.7 Hz, 2H), 7.50–7.58 (m, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.93–8.00 (m, 1H), 8.60 (d, J=2.6 Hz, 1H)	$CDCl_3$
11		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－クロロ－7－(ピリジン－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	409 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.87 (s, 4H), 3.42–3.45 (m, 2H), 3.67 (s, 2H), 3.98–4.01 (m, 2H), 7.32–7.35 (m, 1H), 7.82–7.87 (m, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.98–8.00 (m, 1H), 8.78 (d, J = 4.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
12		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－5－クロロ－7－(ピリジン－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	423 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.62–1.64 (m, 1H), 1.91–1.93 (m, 4H), 1.96–2.07 (m, 1H), 3.27 (d, J = 2.4 Hz, 2H), 3.59–3.63 (m, 2H), 4.21–4.24 (m, 2H), 7.33–7.36 (m, 1H), 7.84–7.88 (m, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.01–8.03 (m, 1H), 8.77–8.79 (m, 1H)	$CDCl_3$
13		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－5－クロロ－7－(ピリジン－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	395 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.66 (d, J=8.0 Hz, 1H), 2.83–2.89 (m, 1H), 3.90–3.92 (m, 2H), 3.95–4.03 (m, 4H), 7.33–7.36 (m, 1H), 7.82–7.86 (m, 1H), 7.99 (s, 1H), 8.06 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.77–8.78 (m, 1H)	$CDCl_3$
14		7－(5－クロロ－7－(ピリジン－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール－2－イル)－3－オキサ－7, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン	425 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 3.03 (s, 2H), 3.67–3.72 (m, 2H), 3.90–3.94 (m, 2H), 4.03–4.05 (m, 2H), 4.44–4.47 (m, 2H), 7.32–7.35 (m, 1H), 7.81–7.86 (m, 1H), 7.92–8.01 (m, 2H), 8.76–8.78 (m, 1H)	$CDCl_3$
15		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－クロロ－7－(1H－ピラゾール－1－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	398 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.87 (s, 4H), 3.44–3.47 (m, 2H), 3.68 (s, 2H), 3.97–4.00 (m, 2H), 6.56–6.57 (m, 1H), 7.79 (s, 2H), 8.23 (d, J=2.4 Hz, 1H)	$CDCl_3$
16		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－5－クロロ－7－(1H－ピラゾール－1－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	412 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.65–1.67 (m, 1H), 1.91–1.93 (m, 4H), 1.96–2.05 (m, 1H), 3.28 (s, 2H), 3.60–3.64 (m, 2H), 4.20–4.23 (m, 2H), 6.58 (dd, J=2.0, 2.0 Hz, 1H), 7.80 (s, 2H), 8.26 (d, J=2.8 Hz, 1H)	$CDCl_3$
17		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－5－クロロ－7－(1H－ピラゾール－1－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	384 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.65–1.67 (m, 1H), 2.85–2.90 (m, 1H), 3.91–3.96 (m, 2H), 3.99–4.03 (m, 4H), 6.57 (dd, J=2.0, 2.0 Hz, 1H), 7.81 (d, J=4.0 Hz, 1H), 7.84 (s, 1H), 8.29 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$

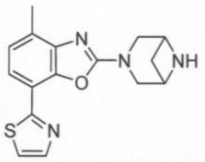
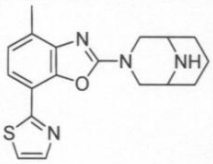
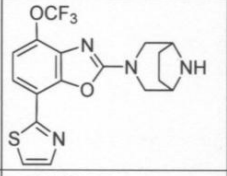
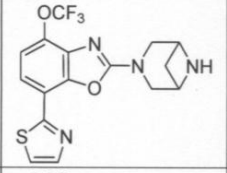
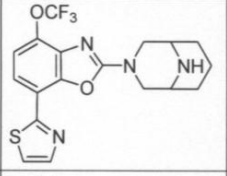
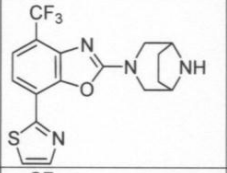
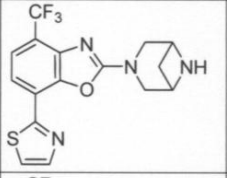
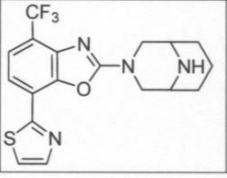
【０５５３】

【表６】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
18		7－(5－クロロ－7－(1H－ピラゾール－1－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール－2－イル)－3－オキサ－7, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン	414 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 3.03 (s, 2H), 3.69-3.72 (m, 2H), 3.91-3.94 (m, 2H), 4.03-4.06 (m, 2H), 4.45 (brs, 2H), 6.55 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.80 (s, 1H), 8.23 (d, J = 2.4 Hz, 1H)	$CDCl_3$
19		7－(5－クロロ－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール－2－イル)－3－オキサ－7, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン	431 $(M+H)^+$	(400 MHz, HCl塩) : 3.80 (s, 2H), 3.94 (d, J=14.6 Hz, 2H), 4.10 (d, J=13.5 Hz, 2H), 4.18-4.25 (m, 2H), 4.56 (d, J=14.6 Hz, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.63 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.71 (d, J=3.3 Hz, 1H)	D_2O
20		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－クロロ－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	415 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.70-1.78 (m, 4H), 3.42 (d, J=11.7 Hz, 2H), 3.62 (s, 2H), 3.87-3.90 (m, 2H), 7.85 (d, J=0.64 Hz, 1H), 8.10 (d, J=3.0 Hz, 1H), 8.13 (d, J=3.0 Hz, 1H)	DMSO-d_6
21		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－イソプロピル－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	355 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.31 (d, J=8.0 Hz, 6H), 1.88 (s, 4H), 3.02-3.06 (m, 1H), 3.41-3.43 (m, 2H), 3.68 (s, 2H), 3.98-4.02 (m, 2H), 7.30 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.45 (d, J=2.8 Hz, 1H), 7.73 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.95 (d, J=2.8 Hz, 1H)	$CDCl_3$
22		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－5－イソプロピル－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	341 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.33 (d, J=4.0 Hz, 6H), 1.69 (d, J=9.6 Hz, 1H), 2.82-2.88 (m, 1H), 3.01-3.08 (m, 1H), 3.91-3.95 (m, 2H), 3.98-4.03 (m, 4H), 7.35 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.46 (d, J=2.8 Hz, 1H), 7.76 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.96 (d, J=2.8 Hz, 1H)	$CDCl_3$
23		7－(5－イソプロピル－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－2－イル)－3－オキサ－7, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン	371 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.31 (d, J=7.2 Hz, 6H), 2.99-3.06 (m, 3H), 3.66-3.71 (m, 2H), 3.90-3.95 (m, 2H), 4.03-4.06 (m, 2H), 4.45-4.48 (m, 2H), 7.30 (s, 1H), 7.44 (d, J=3.6 Hz, 1H), 7.72 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.6 Hz, 1H)	$CDCl_3$
24		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－5－イソプロピル－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	369 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.32 (d, J=6.4 Hz, 6H), 1.60-1.64 (m, 1H), 1.91-1.93 (m, 4H), 2.03-2.13 (m, 1H), 3.01-3.07 (m, 1H), 3.26 (s, 2H), 3.58-3.62 (m, 2H), 4.23-4.27 (m, 2H), 7.32 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.46 (d, J=4.0 Hz, 1H), 7.73 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.96 (d, J = 4.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
25		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－4－メチル－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	327 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.85-1.92 (m, 4H), 2.52 (s, 3H), 3.41-3,44 (m, 2H), 3.67 (s, 2H), 4.01-4.04 (m, 2H), 7.09 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.42 (d, J=3.6 Hz, 1H), 7.75 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.92 (d, J=3.6 Hz, 1H)	$CDCl_3$

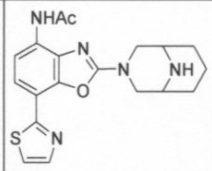
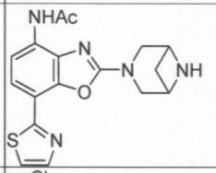
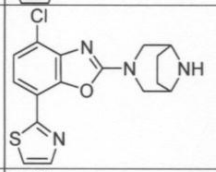
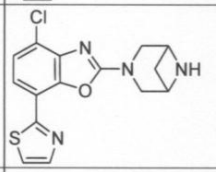
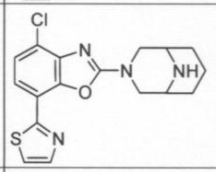
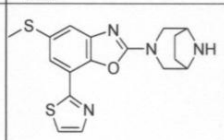
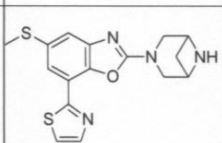
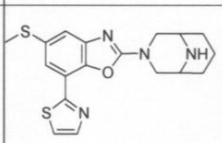
【０５５４】

【表７】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
26		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－4－メチル－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	313 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=10 Hz, 1H), 2.55 (s, 3H), 2.82-2.87 (m, 1H), 3.91-3.93 (m, 2H), 3.97-4.05 (m, 4H), 7.11 (d, J =8.0 Hz, 1H), 7.43 (d, J=2.8 Hz, 1H), 7.78 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.93 (d, J=2.8 Hz, 1H)	$CDCl_3$
27		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－4－メチル－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	341 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.61-1.64 (m, 1H), 1.92-1.95 (m, 4H), 2.09-2.17 (m, 1H), 2.54 (s, 3H), 3.27 (d, J=2.8 Hz, 2H), 3.58-3.62 (m, 2H), 4.25-4.28 (m, 2H), 7.10 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.43 (d, J=2.8 Hz, 1H), 7.76 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.93 (d, J=2.8 Hz, 1H)	$CDCl_3$
28		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	397 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.90-1.93 (m, 4H), 3.53 (d, J=12.6 Hz, 2H), 3.76 (s, 2H), 4.08 (d, J=12.6 Hz, 2H), 7.15-7.22 (m, 1H), 7.48 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.84 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
29		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	383 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.81-2.93 (m, 1H), 3.94 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.98-4.10 (m, 4H), 7.17-7.24 (m, 1H), 7.48 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.87 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
30		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	411 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.63-1.66 (m, 1H), 1.97-2.07 (m, 5H), 3.36 (s, 2H), 3.71 (d, J=9.9 Hz, 2H), 4.32 (d, J=12.8 Hz, 2H), 7.18-7.21 (m, 1H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.85 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
31		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	381 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89 (s, 4H), 3.45-3.49 (m, 2H), 3.69 (s, 2H), 4.07-4.10 (m, 2H), 7.50 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.53 (d, J=2.8 Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.0 Hz, 1H), 8.01 (d, J=2.8 Hz, 1H)	$CDCl_3$
32		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	367 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.84-2.90 (m, 1H), 3.94 (d, J=6.0 Hz, 2H), 4.01-4.09 (m, 4H), 7.52-7.55 (m, 2H), 7.93 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.01 (d, J=2.8 Hz, 1H)	$CDCl_3$
33		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	395 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.62-1.67 (m, 1H), 1.93-1.94 (m, 4H), 2.01-2.06 (m, 1H), 3.28 (s, 2H), 3.62-3.67 (m, 2H), 4.30-4.33 (m, 2H), 7.49-7.54 (m, 2H), 7.90 (d, J=8.8 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$

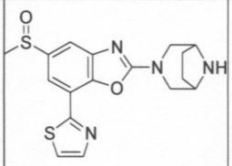
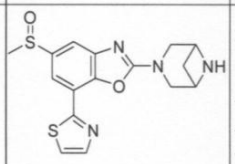
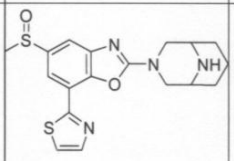
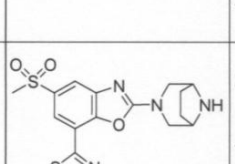
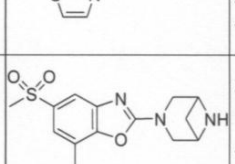
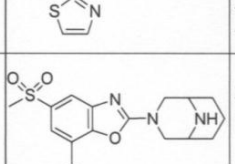
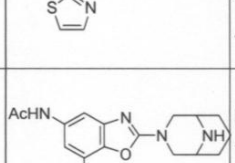
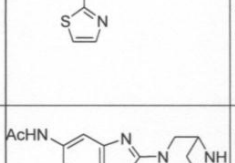
【０５５５】

【表８】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ（ppm）	重溶媒
34		N－(2－(3，9－ジアザビシクロ[3．3．1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)アセトアミド	384 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.64–1.68 (m，1H)，1.92–1.95 (m，4H)，2.02–2.10 (m，1H)，2.28 (s，3H)，3.28 (brs，2H)，3.61 (dd，J=12.3，4.1 Hz，2H)，4.25 (d，J=12.3 Hz，2H)，7.40 (d，J=3.3 Hz，1H)，7.81 (d，J=8.8 Hz，1H)，7.92 (d，J=3.3 Hz，1H)，8.27 (d，J=8.8 Hz，1H)	$CDCl_3$
35		N－(2－(3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)アセトアミド	356 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.77–1.79 (m，1H)，2.24 (s，3H)，2.81–2.86 (m，1H)，3.88–3.89 (m，2H)，4.01–4.06 (m，4H)，7.71 (d，J=3.3 Hz，1H)，7.76 (d，J=8.4 Hz，1H)，7.93 (d，J=3.3 Hz，1H)，8.04 (d，J=8.4 Hz，1H)	CD_3OD
36		2－(3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル)－4－クロロ－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	347 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.89 (s，4H)，3.45–3.48 (m，2H)，3.69 (s，2H)，4.04–4.07 (m，2H)，7.27 (d，J=8.4 Hz，1H)，7.47 (d，J=2.8 Hz，1H)，7.79 (d，J=8.4 Hz，1H)，7.95 (d，J=2.8 Hz，1H)	$CDCl_3$
37		2－(3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル)－4－クロロ－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	333 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.70 (d，J=3.2 Hz，1H)，2.84–2.91 (m，1H)，3.96 (d，J=6.0 Hz，2H)，4.01–4.09 (m，4H)，7.31 (d，J=8.4 Hz，1H)，7.48 (d，J=3.2 Hz，1H)，7.82 (d，J=8.4 Hz，1H)，7.96 (d，J=3.2 Hz，1H)	$CDCl_3$
38		2－(3，9－ジアザビシクロ[3．3．1]ノナン－3－イル)－4－クロロ－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	361 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.64 (s，1H)，1.93–1.94 (m，4H)，2.02–2.11 (m，1H)，3.28 (s，2H)，3.61–3.66 (m，2H)，4.28–4.31 (m，2H)，7.26–7.29 (m，1H)，7.47 (d，J=3.6 Hz，1H)，7.80 (d，J=8.4 Hz，1H)，7.96 (d，J=3.6 Hz，1H)	$CDCl_3$
39		2－(3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル)－5－(メチルチオ)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	359 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.88 (s，4H)，2.55 (s，3H)，3.43 (dd，J=12.2，2.0 Hz，2H)，3.67 (s，2H)，3.99 (dd，J=12.2，2.0 Hz，2H)，7.33 (d，J=1.8 Hz，1H)，7.47 (d，J=3.2 Hz，1H)，7.80 (d，J=1.8 Hz，1H)，7.96 (d，J=3.2 Hz，1H)	$CDCl_3$
40		2－(3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル)－5－(メチルチオ)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	345 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.70 (d，J=9.2 Hz，1H)，2.56 (s，3H)，2.84–2.89 (m，1H)，3.93 (d，J=5.6 Hz，2H)，3.96–4.03 (m，4H)，7.38 (d，J=1.8 Hz，1H)，7.48 (d，J=3.3 Hz，1H)，7.82 (d，J=1.8 Hz，1H)，7.97 (d，J=3.3 Hz，1H)	$CDCl_3$
41		2－(3，9－ジアザビシクロ[3．3．1]ノナン－3－イル)－5－(メチルチオ)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	373 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.55–1.61 (m，1H)，1.86–1.96 (m，4H)，1.99–2.15 (m，1H)，2.55 (s，3H)，3.27 (brs，2H)，3.62 (dd，J=12.7，3.8 Hz，2H)，4.25 (d，J=12.7 Hz，2H)，7.35 (d，J=1.8 Hz，1H)，7.48 (d，J=3.3 Hz，1H)，7.80 (d，J=1.8 Hz，1H)，7.96 (d，J=3.3 Hz，1H)	$CDCl_3$

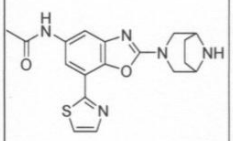
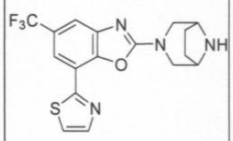
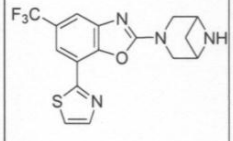
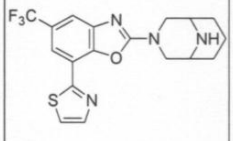
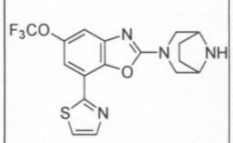
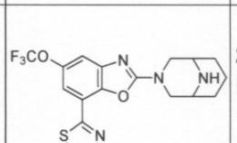
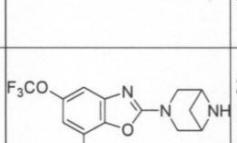
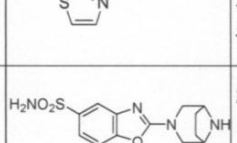
【０５５６】

【表９】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
42		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－(メチルスルフィニル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	375 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.92 (s, 4H), 2.76 (s, 3H), 3.51 (d, J=11.9 Hz, 2H), 3.74 (s, 2H), 4.04 (d, J=11.9 Hz, 2H), 7.52 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.72 (d, J=1.7 Hz, 1H), 7.99 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.09 (d, J=1.7 Hz, 1H)	$CDCl_3$
43		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－5－(メチルスルフィニル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	361 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.71 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.79 (s, 3H), 2.88–2.90 (m, 1H), 3.95 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.99–4.06 (m, 4H), 7.52–7.53 (m, 1H), 7.78 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.12 (d, J=1.6 Hz, 1H)	$CDCl_3$
44		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－5－(メチルスルフィニル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	389 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.60–1.70 (m, 1H), 1.92–1.94 (m, 4H), 2.00–2.07 (m, 1H), 2.77 (s, 3H), 3.29 (s, 2H), 3.67 (dd, J=13.4, 3.9 Hz, 2H), 4.29 (d, J=13.4 Hz, 2H), 7.53 (d, J=2.8 Hz, 1H), 7.73 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.99 (d, J=2.8 Hz, 1H), 8.09 (d, J=1.6 Hz, 1H)	$CDCl_3$
45		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－(メチルスルホニル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	391 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.90 (s, 4H), 3.10 (s, 3H), 3.51 (d, J=11.5 Hz, 2H), 3.72 (s, 2H), 4.03 (d, J=11.5 Hz, 2H), 7.54 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.90 (d, J=1.7 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.47 (d, J=1.7 Hz, 1H)	$CDCl_3$
46		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－5－(メチルスルホニル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	377 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.71 (d, J=9.6 Hz, 1H), 2.87–2.93 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 3.97 (d, J=6.1 Hz, 2H), 4.04 (s, 4H), 7.55 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.95 (d, J=1.8 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.50 (d, J=1.8 Hz, 1H)	$CDCl_3$
47		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－5－(メチルスルホニル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	405 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.64–1.66 (m, 1H), 1.92–2.04 (m, 5H), 3.11 (s, 3H), 3.34 (s, 2H), 3.71 (dd, J=13.0, 3.7 Hz, 2H), 4.26–4.29 (m, 2H), 7.55 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.92 (d, J=1.7 Hz, 1H), 8.02 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.48 (d, J=1.7 Hz, 1H)	$CDCl_3$
48		N－(2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)アセトアミド	384 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.61–1.68 (m, 1H), 1.92–1.94 (m, 4H), 2.00–2.10 (m, 1H), 2.20 (s, 3H), 3.26 (s, 2H), 3.60 (dd, J=12.6, 3.7 Hz, 2H), 4.23–4.26 (m, 2H), 7.47 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.76 (d, J=1.8 Hz, 1H), 7.81 (d, J=1.8 Hz, 1H), 7.94 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
49		N－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)アセトアミド	356 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.1 Hz, 1H), 2.21 (s, 3H), 2.83–2.89 (m, 1H), 3.91–4.03 (m, 6H), 7.47 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.79 (d, J=1.7 Hz, 1H), 7.86 (d, J=1.7 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$

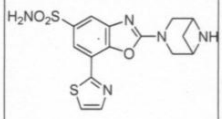
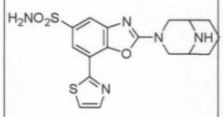
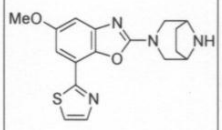
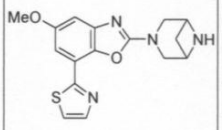
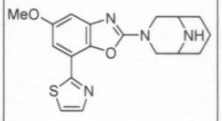
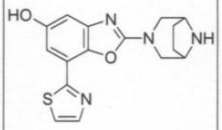
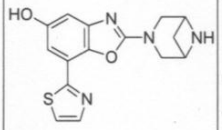
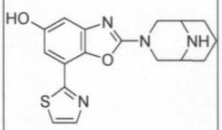
【０５５７】

【表１０】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
50		N－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)アセトアミド	370 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89 (s, 4H), 2.20 (s, 3H), 3.43 (d, J=12.3 Hz, 2H), 3.68 (brs, 2H), 4.00 (d, J=12.3 Hz, 2H), 7.46 (d, J=3.1 Hz, 1H), 7.78 (d, J=8.8 Hz, 2H), 7.94 (d, J=3.1 Hz, 1H)	$CDCl_3$
51		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	381 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89 (s, 4H), 3.47 (dd, J=12.2, 2.1 Hz, 2H), 3.70 (s, 2H), 4.02 (dd, J=12.2, 2.1 Hz, 2H), 7.52 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.60 (d, J=1.2 Hz, 1H), 7.99 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.17 (d, J=1.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
52		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	367 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.75–1.78 (m, 1H), 2.92–3.01 (m, 1H) 4.02–4.05 (m, 2H), 4.06–4.08 (m, 2H), 4.19 (brs, 2H), 7.53 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.67 (s, 1H), 8.00 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.21 (s, 1H)	$CDCl_3$
53		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	395 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.53–1.59 (m, 1H), 1.91–2.04 (m, 5H), 3.44 (brs, 2H), 3.66 (dd, J= 13.6, 3.6 Hz, 2H), 4.30 (d, J=13.6 Hz, 2H), 7.53 (s, 1H), 7.75 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.93 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.03 (s, 1H)	CD_3OD
54		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	397 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.84–1.97 (m, 4H), 3.47 (dd, J=12.2, 2.0 Hz, 2H), 3.65–3.77 (m, 2H), 4.01 (dd, J=12.2, 2.0 Hz, 2H), 7.24 (dd, J=2.2, 1.0 Hz, 1H), 7.50 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.75 (dd, J=2.2, 1.0 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
55		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	411 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.57–1.70 (m, 1H), 1.86–1.97 (m, 4H), 2.01–2.15 (m, 1H), 3.25–3.35 (m, 2H), 3.64 (dd, J=12.8, 3.9 Hz, 2H), 4.25 (d, J=12.8 Hz, 2H), 7.26 (dd, J=2.2, 0.9 Hz, 1H), 7.51 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.75 (dd, J=2.2, 0.9 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
56		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	383 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.1 Hz, 1H), 2.88 (dt, J=9.1, 6.3 Hz, 1H), 3.88–4.08 (m, 6H), 7.26–7.32 (m, 1H), 7.50 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.77 (dd, J=2.3, 0.9 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
57		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－スルホンアミド	392 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.66–1.74 (m, 4H), 3.37–3.41 (m, 2H), 3.55 (s, 2H), 3.85 (d, J=10.3 Hz, 2H), 7.43 (s, 2H), 7.69 (d, J=1.8 Hz, 1H), 8.02 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.09 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.26 (d, J=1.8 Hz, 1H)	DMSO–d_6

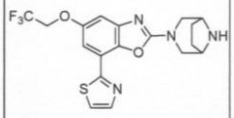
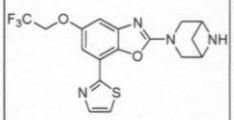
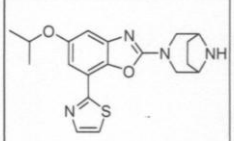
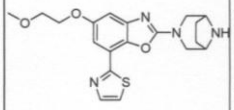
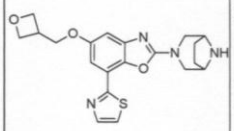
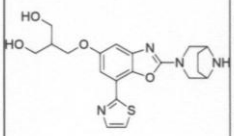
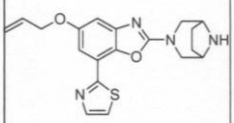
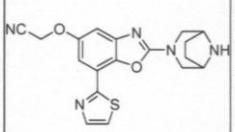
【０５５８】

【表１１】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
58		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－スルホンアミド	378 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.59–1.62 (m, 1H), 2.56–2.61 (m, 1H), 3.70–3.71 (m, 2H), 3.90 (brs, 4H), 7.38 (brs, 2H), 7.75 (d, J=1.7 Hz, 1H), 8.04 (d, J=3.0 Hz, 1H), 8.10 (d, J=3.0 Hz, 1H), 8.29 (d, J=1.7 Hz, 1H)	DMSO-d_6
59		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－スルホンアミド	406 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.51 (brs, 1H), 1.66–1.84 (m, 5H), 3.12 (s, 2H), 3.56 (dd, J=12.7, 3.7 Hz, 2H), 4.10 (d, J=12.7 Hz, 2H), 7.43 (brs, 2H), 7.70 (d, J=1.8 Hz, 1H), 8.02 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.09 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.26 (d, J=1.8 Hz, 1H)	DMSO-d_6
60		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－メトキシ－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	343 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.88 (s, 4H), 3.40–3.44 (m, 2H), 3.67 (s, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.97–4.0 (m, 2H), 6.99 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.40 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.46 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
61		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－5－メトキシ－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	329 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=8.8 Hz, 1H), 2.83–2.88 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.90–4.03 (m, 6H), 7.04 (d, J=2.8 Hz, 1H), 7.43 (d, J=2.8 Hz, 1H), 7.48 (d, J=3.6 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.6 Hz, 1H)	$CDCl_3$
62		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－5－メトキシ－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	357 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.63–1.65 (m, 1H), 1.91–1.93 (m, 4H), 2.03–2.13 (m, 1H), 3.27 (d, J=2.8 Hz, 2H), 3.58–3.62 (m, 2H), 3.89 (s, 3H), 4.23–4.26 (m, 2H), 7.01 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.40 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
63		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－オール	329 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.84–1.88 (m, 2H), 1.90–1.94 (m, 2H), 3.40–3.43 (m, 2H), 3.65 (d, J=1.6 Hz, 2H), 3.92–3.96 (m, 2H), 6.82 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.22 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.74 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.2 Hz, 1H)	CD_3OD
64		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－オール	315 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.74–1.76 (m, 1H), 2.79–2.84 (m, 1H), 3.86 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.96–3.97 (m, 4H), 6.84 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.23 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.73 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.94 (d, J=3.2 Hz, 1H)	CD_3OD
65		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－オール	343 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.61–1.64 (m, 1H), 1.92–1.93 (m, 4H), 2.01–2.13 (m, 1H), 3.28 (s, 2H), 3.59–3.63 (m, 2H), 4.21–4.25 (m, 2H), 6.93 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.34 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.94 (d, J=3.2 Hz, 1H)	CD_3OD

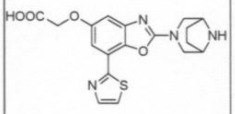
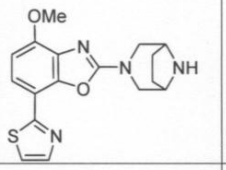
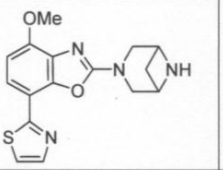
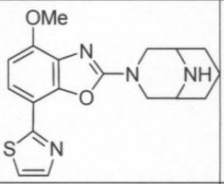
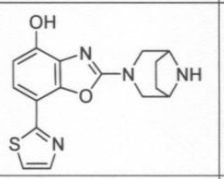
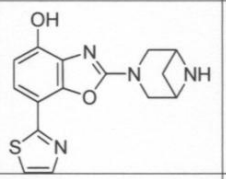
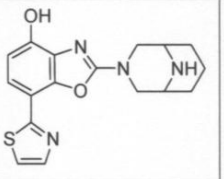
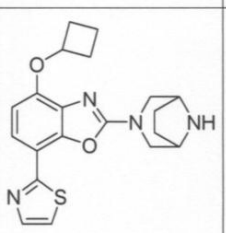
【０５５９】

【表１２】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
66		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(2, 2, 2－トリフルオロエトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	411 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.95–2.11 (m, 2H), 2.11–2.23 (m, 2H), 3.74 (d, J=12.5 Hz, 2H), 4.00 (brs, 2H), 4.05–4.20(m, 2H), 4.44 (q, J=8.1 Hz, 2H), 7.04 (d, J=2.5 Hz, 1H), 7.48 (d, J=2.5 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
67		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(2, 2, 2－トリフルオロエトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	397 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.75–2.99 (m, 1H), 3.85–3.96 (m, 2H), 4.01 (brs, 4H), 4.45 (q, J=8.1 Hz, 2H), 7.08 (d, J=2.6 Hz, 1H), 7.48 (d, J=2.6 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
68		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－イソプロポキシ－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	371 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.34 (d, J=6.0 Hz, 6H), 1.74–1.98 (m, 4H), 3.42 (dd, J=12.3, 2.1 Hz, 2H), 3.61–3.67 (m, 2H), 3.94 (dd, J=12.3, 2.1 Hz, 2H), 4.61 (spt, J=6.0 Hz, 1H), 6.91 (d, J=2.3 Hz, 1H), 7.32 (d, J=2.3 Hz, 1H), 7.73 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
69		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－(2－メトキシエトキシ)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	387 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.75–1.99 (m, 4H), 3.36–3.47 (m, 2H), 3.44 (s, 3H), 3.62–3.71 (m, 2H), 3.73–3.81 (m, 2H), 3.95 (dd, J=12.3, 2.1 Hz, 2H), 4.15–4.21 (m, 2H), 6.96 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.36 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.74 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
70		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－(オキセタン－3－イルメトキシ)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	399 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.85–2.05 (m, 4H), 3.43–3.54 (m, 3H), 3.75–3.82 (m, 2H), 4.01 (dd, J=12.7, 2.0 Hz, 2H), 4.28 (d, J=6.4 Hz, 2H), 4.63 (t, J=6.1 Hz, 2H), 4.89 (dd, J=7.9, 6.2 Hz, 2H), 6.99 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.39 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.75 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
71		2－(((2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)オキシ)メチル)プロパン－1, 3－ジオール	417 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.84–2.04 (m, 4H), 2.16 (q, J=5.9 Hz, 1H), 3.47 (dd, J=12.7, 1.7 Hz, 2H), 3.76 (d, J=6.0 Hz, 4H), 3.75–3.83 (m, 2H), 4.01 (dd, J=12.7, 2.0 Hz, 2H), 4.13 (d, J=5.7 Hz, 2H), 6.98 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.37 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.75 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
72		5－(アリルオキシ)－2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	369 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.83–2.02 (m, 4H), 3.46 (dd, J=12.6, 1.9 Hz, 2H), 3.68–3.79 (m, 2H), 3.98 (dd, J=12.6, 2.0 Hz, 2H), 4.59–4.63 (m, 2H), 5.25–5.29 (m, 1H), 5.40–5.47 (m, 1H), 6.09 (ddt, J=17.3, 10.5, 5.2 Hz, 1H), 6.95 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.35 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.74 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
73		2－((2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)オキシ)アセトニトリル	368 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.92 (brs, 2H), 1.97–2.13 (m, 2H), 3.50 (d, J=11.9 Hz, 2H), 3.75 (brs, 2H), 4.02 (d, J=11.9 Hz, 2H), 4.84 (s, 2H), 7.06 (d, J=2.6 Hz, 1H), 7.46–7.52 (m, 2H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$

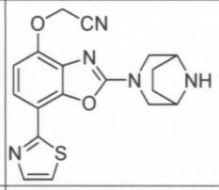
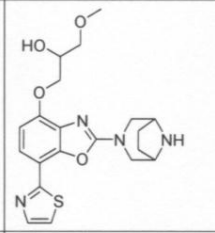
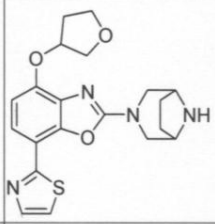
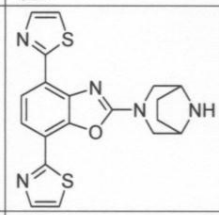
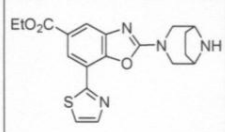
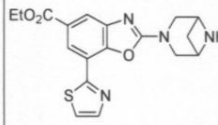
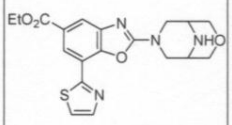
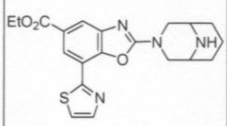
【０５６０】

【表１３】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
74		2－((2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)オキシ)酢酸	387 $(M+H)^+$	(400 MHz, TFA塩) : 2.11–2.22 (m, 4H), 3.58–3.72 (m, 2H), 4.21–4.28 (m, 4H), 4.74 (s, 2H), 7.04 (d, J=2.5 Hz, 1H), 7.41 (d, J=2.5 Hz, 1H), 7.77 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
75		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－4－メトキシ－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	343 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.84–1.92 (m, 4H), 3.40–3.43 (m, 2H), 3.66 (s, 2H), 4.02 (s, 3H), 4.03–4.07 (m, 2H), 6.83 (d, J=9.3 Hz, 1H), 7.38 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.84 (d, J=9.3 Hz, 1H), 7.90 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
76		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－4－メトキシ－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	329 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.67 (d, J=8.0 Hz, 1H), 2.81–2.87 (m, 1H), 3.92 (s, 2H), 4.04 (s, 3H), 3.98–4.06 (m, 4H), 6.86 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.39 (d, J=2.8 Hz, 1H), 7.86 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.90 (d, J=2.8 Hz, 1H)	$CDCl_3$
77		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－4－メトキシ－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	357 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.61–1.63 (m, 1H), 1.91–1.93 (m, 4H), 2.06–2.14 (m, 1H), 3.26 (s, 2H), 3.57–3.61(m, 2H), 4.03 (s, 3H), 4.28–4.31 (m, 2H), 6.84 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.39 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.84 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.90 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
78		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－オール	329 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.90 (s, 4H), 3.44–3.47 (m, 2H), 3.72 (s, 2H), 3.96–3.98 (m, 2H), 6.83 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.36 (d, J=3.6 Hz, 1H), 7.76 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.89 (d, J=3.6 Hz, 1H)	$\cdot CDCl_3$
79		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－オール	315 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.95–1.98 (m, 1H), 2.88–2.91 (m, 1H), 4.11 (brs, 4H), 4.32–4.45 (m, 2H), 6.80 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.67 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.82 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J=3.3 Hz, 1H), 10.32 (brs, 1H)	DMSO–d_6
80		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－オール	343 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.62–1.66 (m, 1H), 1.87–2.00 (m, 4H), 2.01–2.18 (m, 1H), 3.31 (s, 2H), 3.62 (d, J=12.7, 4.0 Hz, 2H), 4.22 (d, J=12.7 Hz, 2H), 6.84 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.37 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.76 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.89 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
81		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－4－シクロブトキシ－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	383 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69–1.81 (m, 1H), 1.81–1.97 (m, 5H), 2.18–2.33 (m, 2H), 2.46–2.61 (m, 2H), 3.41 (dd, J=12.3, 2.1 Hz, 2H), 3.60–3.69 (m, 2H), 3.98 (dd, J=12.3, 2.1 Hz, 2H), 4.94 (quin, J=7.0 Hz, 1H), 6.78 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.64 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.70 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.88 (d, J=3.4 Hz, 1H)	CD_3OD

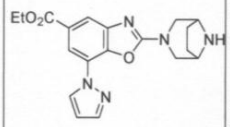
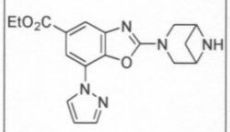
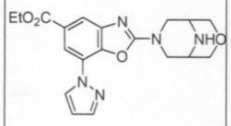
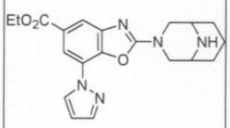
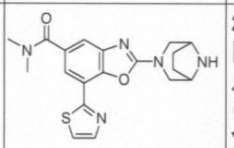
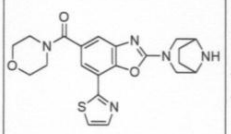
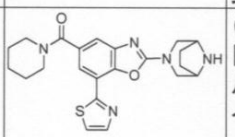
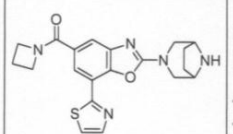
【０５６１】

【表１４】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
82		2－((2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)アセトニトリル	368 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.79-1.98 (m, 4H), 3.43 (dd, J=12.4, 2.1 Hz, 2H), 3.59-3.69 (m, 2H), 3.98 (dd, J=12.4, 2.1 Hz, 2H), 5.32 (s, 2H), 7.00 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.67 (d, J=3.4 Hz, 1H), 7.74 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.90 (d, J=3.4 Hz, 1H)	CD_3OD
83		1－((2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－3－メトキシプロパン－2－オール	417 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.82-2.01 (m, 4H), 3.40 (s, 3H), 3.45 (dd, J=12.3, 1.8 Hz, 2H), 3.54-3.64 (m, 2H), 3.65-3.75 (m, 2H), 3.98 (dd, J=12.3, 2.0 Hz, 2H), 4.12-4.21 (m, 2H), 4.26-4.33 (m, 1H), 6.93 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.65 (d, J=3.4 Hz, 1H), 7.73 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.89 (d, J=3.4 Hz, 1H)	CD_3OD
84		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－4－((テトラヒドロフラン－3－イル)オキシ)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	399 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.82-2.00 (m, 4H), 2.17-2.37 (m, 2H), 3.44 (dd, J=12.5, 1.8 Hz, 2H), 3.66-3.74 (m, 2H), 3.90 (td, J=8.3, 4.3 Hz, 1H), 3.97-4.08 (m, 5H), 5.42 (ddt, J=5.8, 3.8, 2.0 Hz, 1H), 6.89 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.65 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.73 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.89 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
85		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－4, 7－ジ(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	396 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89-2.00 (s, 4H), 3.52-3.59 (m, 2H), 3.72-3.79 (m, 2H), 4.16 (dd, J=12.5, 1.7 Hz, 2H), 7.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.93 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.99 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.22 (d, J=8.5 Hz, 1H)	$CDCl_3$
86		エチル 2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	385 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.43 (t, J=6.8 Hz, 3H), 1.90 (s, 4H), 3.44-3.47 (m, 2H), 3.70 (s, 2H), 4.00-4.03 (m, 2H), 4.38-4.43 (m, 2H), 7.50 (d, J=2.8 Hz, 1H), 8.00 (d, J=2.8 Hz, 1H), 8.07 (d, J=1.6 Hz, 1H), 8.58 (d, J=1.6 Hz, 1H)	$CDCl_3$
87		エチル 2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	371 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.44 (t, J=7.2 Hz, 3H), 1.71 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.85-2.90 (m, 1H), 3.94 (d, J=5.2 Hz, 2H), 3.98-4.05 (m, 4H), 4.44 (q, J=7.2 Hz, 2H), 7.51 (d, J=2.8 Hz, 1H), 8.01 (d, J=2.8 Hz, 1H), 8.13 (d, J=1.6 Hz, 1H), 8.61 (d, J=1.6 Hz, 1H)	$CDCl_3$
88		エチル 2－(3－オキサ－7, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－7－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	401 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.43 (t, J=7.2 Hz, 3H), 3.04 (s, 2H), 3.70-3.73 (m, 2H), 3.92-3.95 (m, 2H), 4.04-4.07 (m, 2H), 4.40 (q, J=7.2 Hz, 2H), 4.47-4.50 (m, 2H), 7.49 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.00 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.07 (d, J=1.2 Hz, 1H), 8.58 (d, J=1.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
89		エチル 2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	399 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.44 (t, J=7.6 Hz, 3H), 1.57-1.65 (m, 1H), 1.92-1.94 (m, 4H), 2.02-2.12 (m, 1H), 3.29 (brs, 2H), 3.62-3.66 (m, 2H), 4.25-4.28 (m, 2H), 4.44 (q, J=7.6 Hz, 2H), 7.51 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.09 (d, J=1.2 Hz, 1H), 8.59 (d, J=1.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$

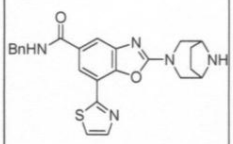
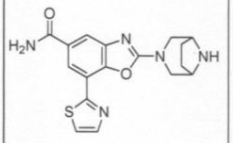
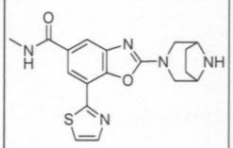
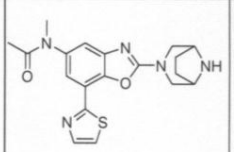
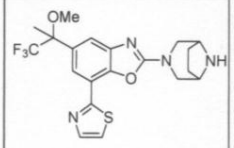
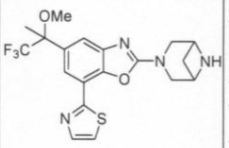
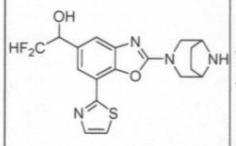
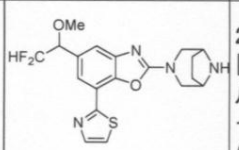
【０５６２】

【表１５】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
90		エチル 2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(1H－ピラゾール－1－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	368 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.42 (t, J=7.2 Hz, 3H), 1.89 (s, 4H), 3.43-3.46 (m, 2H), 3.70 (s, 2H), 3.93-3.96 (m, 2H), 4.42 (q, J=7.2 Hz, 2H), 6.54-6.55 (m, 1H), 7.80 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.96 (d, J=1.2 Hz, 1H), 8.19 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.30 (d, J=1.6 Hz, 1H)	$CDCl_3$
91		エチル 2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(1H－ピラゾール－1－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	354 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.43 (t, J=6.8 Hz, 3H), 1.69 (d, J=1.2 Hz, 1H), 2.84-2.89 (m, 1H), 3.93 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.98-4.01 (m, 4H), 4.43 (q, J=6.8 Hz, 2H), 6.54-6.55 (m, 1H), 7.81 (d, J=1.2 Hz, 1H), 8.01 (d, J=1.2 Hz, 1H), 8.24 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.33 (d, J=2.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
92		エチル 2－(3－オキサ－7, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－7－イル)－7－(1H－ピラゾール－1－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	384 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.42 (t, J=7.2 Hz, 3H), 3.03 (s, 2H), 3.67-3.70 (m, 2H), 3.91-3.94 (m, 2H), 4.02-4.05 (m, 2H), 4.38-4.43 (m, 4H), 6.53-6.54 (m, 1H), 7.80 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.95 (d, J=1.2 Hz, 1H), 8.20 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.28 (d, J=1.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
93		エチル 2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(1H－ピラゾール－1－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	382 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.43 (t, J=7.2 Hz, 3H), 1.60-1.65 (m, 1H), 1.91-1.93 (m, 4H), 2.09-2.11 (m, 1H), 3.27 (s, 2H), 3.59-3.63 (m, 2H), 4.17-4.20 (m, 2H), 4.43 (q, J=7.2 Hz, 2H), 6.55-6.56 (m, 1H), 7.81 (d, J=1.2 Hz, 1H), 7.97 (d, J=1.2 Hz, 1H), 8.22 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.31 (d, J=2.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
94		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－N, N－ジメチル－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキサミド	384 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.76-1.95 (m, 4H), 2.97 (brs, 3H), 3.04 (brs, 3H), 3.41 (dd, J=12.6, 1.7 Hz, 2H), 3.65-3.72 (m, 2H), 3.95 (dd, J=12.6, 2.0 Hz, 2H), 7.31 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.69 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.77 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.89 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
95		(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)(モルホリノ)メタノン	426 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.72-1.89 (m, 4H), 3.32-3.76 (m, 10H), 3.38 (dd, J= 12.4, 1.8 Hz, 2H), 3.91 (dd, J=12.4, 1.9 Hz, 2H), 7.30 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.68 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.76 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.88 (d, J=3.2 Hz, 1H)	CD_3OD
96		(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)(ピペリジン－1－イル)メタノン	424 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.41-1.69 (m, 6H), 1.70-1.89 (m, 4H), 3.36 (dd, J=12.3, 1.8 Hz, 4H), 3.49-3.71 (m, 4H), 3.88 (dd, J=12.3, 1.9 Hz, 2H), 7.25 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.68 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.73 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.87 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
97		(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)(アゼチジン－1－イル)メタノン	396 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.75-1.94 (m, 4H), 2.30 (quin, J=7.8 Hz, 2H), 3.41 (dd, J=12.7, 1.7 Hz, 2H), 3.65-3.72 (m, 2H), 3.94 (dd, J=12.5, 1.7 Hz, 2H), 4.14 (t, J=7.8 Hz, 2H), 4.36 (t, J=7.8 Hz, 2H), 7.50 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.69 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.89 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.99 (d, J=1.6 Hz, 1H)	CD_3OD

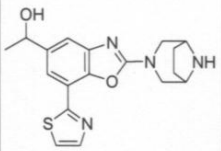
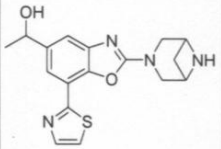
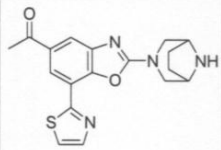
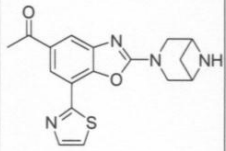
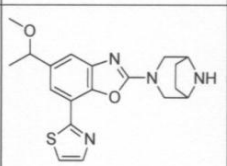
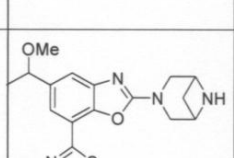
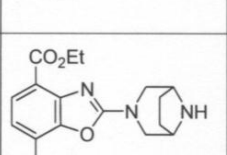
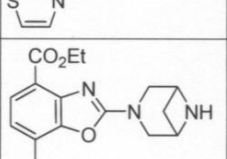
【０５６３】

【表１６】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
98		Ｎ－ベンジル－２－（３，８－ジアザビシクロ[３．２．１]オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ[ｄ]オキサゾール－５－カルボキサミド	446 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.78–1.98 (m, 4H), 3.43 (dd, J=12.4, 1.6 Hz, 2H), 3.61–3.70 (m, 2H), 3.94 (dd, J=12.4, 1.3 Hz, 2H), 4.58 (s, 2H), 7.19–7.26 (m, 1H), 7.28–7.35 (m, 2H), 7.35–7.40 (m, 2H), 7.71 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.76 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.93 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.27 (d, J=1.6 Hz, 1H)	CD_3OD
99		２－（３，８－ジアザビシクロ[３．２．１]オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ[ｄ]オキサゾール－５－カルボキサミド	356 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.86–2.04 (m, 4H), 3.51 (dd, J=12.5, 1.8 Hz, 2H), 3.72–3.77 (m, 2H), 4.02 (dd, J=12.5, 2.0 Hz, 2H), 7.68 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.88 (d, J=1.7 Hz, 1H), 7.99 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.36 (d, J=1.7 Hz, 1H)	CD_3OD
100		２－（３，８－ジアザビシクロ[３．２．１]オクタン－３－イル）－Ｎ－メチル－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ[ｄ]オキサゾール－５－カルボキサミド	370 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.78–2.00 (m, 4H), 2.94 (s, 3H), 3.45 (dd, J=12.4, 1.8 Hz, 2H), 3.65–3.71 (m, 2H), 3.96 (dd, J=12.4, 1.8 Hz, 2H), 7.71 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.73 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.23 (d, J=1.6 Hz, 1H)	CD_3OD
101		Ｎ－（２－（３，８－ジアザビシクロ[３．２．１]オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ[ｄ]オキサゾール－５－イル）－Ｎ－メチルアセトアミド	384 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.85–2.05 (m, 4H), 1.93 (s, 3H), 3.33 (s, 3H), 3.52 (dd, J=12.3, 1.6 Hz, 2H), 3.54–3.56 (m, 2H), 4.05 (dd, J=12.3, 1.5 Hz, 2H), 7.32 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.73 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.83 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.2 Hz, 1H)	CD_3OD
102		２－（３，８－ジアザビシクロ[３．２．１]オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ[ｄ]オキサゾール	439 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.87–1.90 (m, 7H), 3.26 (s, 3H), 3.46 (dd, J=12.2, 1.7 Hz, 2H), 3.70 (s, 2H), 4.01–4.03 (m, 2H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.61 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.00 (d, J=1.6 Hz, 1H)	$CDCl_3$
103		２－（３，６－ジアザビシクロ[３．１．１]ヘプタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）－５－（１，１，１－トリフルオロ－２－メトキシプロパン－２－イル）ベンゾ[ｄ]オキサゾール	425 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 1.89 (s, 3H), 2.85–2.90 (m, 1H), 3.28 (s, 3H), 3.94 (d, J=6.1 Hz, 2H), 3.97–4.05 (m, 4H), 7.49 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.67 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.80 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.99 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
104		１－（２－（３，８－ジアザビシクロ[３．２．１]オクタン－３－イル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ[ｄ]オキサゾール－５－イル）－２，２－ジフルオロエタン－１－オール	393 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.58–1.80 (m, 4H), 3.25–3.39 (m, 2H), 3.54 (s, 2H), 3.83 (d, J=10.1 Hz, 2H), 4.80–4.95 (m, 1H), 5.86–6.22 (m, 1H), 6.30 (d, J=5.1 Hz, 1H), 7.39 (d, J=1.3 Hz, 1H), 7.84 (d, J=1.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.03 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO–d_6
105		２－（３，８－ジアザビシクロ[３．２．１]オクタン－３－イル）－５－（２，２－ジフルオロ－１－メトキシエチル）－７－（チアゾール－２－イル）ベンゾ[ｄ]オキサゾール	407 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89 (d, J=1.7 Hz, 4H), 3.38 (s, 3H), 3.45 (dd, J=12.2, 2.1 Hz, 2H), 3.69 (s, 2H), 4.02 (dd, J=12.2, 2.1 Hz, 2H), 4.43 (td, J=9.9, 4.7 Hz, 1H), 5.66–5.99 (m, 1H), 7.43 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.87 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$

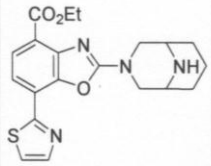
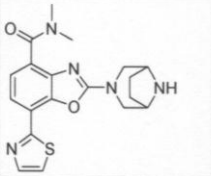
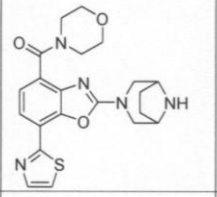
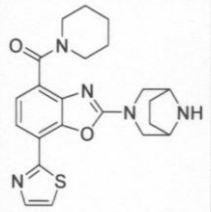
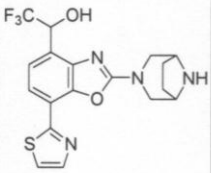
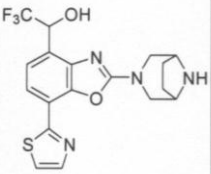
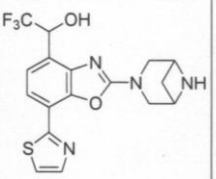
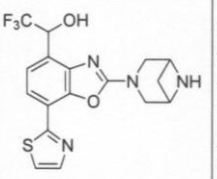
【０５６４】

【表１７】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ（ppm）	重溶媒
106		1－（2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）エタン－1－オール	357 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.55 (d, J=6.5 Hz, 3H), 1.89 (s, 4H), 3.42 (d, J=11.1 Hz, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.00 (d, J=9.9 Hz, 2H), 5.02 (q, J=6.5 Hz, 1H), 7.45-7.46 (m, 2H), 7.85 (d, J=1.2 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
107		1－（2－（3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）エタン－1－オール	343 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.42 (d, J=6.5 Hz, 3H), 2.02 (d, J=10.9 Hz, 1H), 3.01-3.11 (m, 1H), 4.14-4.25 (m, 4H), 4.51 (d, J=6.1 Hz, 2H), 4.87 (q, J=6.5 Hz, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.67 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.88 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
108		1－（2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）エタン－1－オン	355 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.88-1.92 (m, 4H), 2.70 (s, 3H), 3.47 (dd, J=12.2, 1.9 Hz, 2H), 3.70 (s, 2H), 3.98-4.06 (m, 2H), 7.50 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.98-8.01 (m, 2H), 8.51 (s, 1H)	$CDCl_3$
109		1－（2－（3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）エタン－1－オン	341 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.59-1.66 (m, 1H), 2.59-2.63 (m, 1H), 2.67 (s, 3H), 3.71-3.79 (m, 2H), 3.85-4.01 (m, 4H), 7.98 (s, 1H), 8.02 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.09 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.40 (s, 1H)	DMSO-d_6
110		2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－5－（1－メトキシエチル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール	371 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.48 (d, J=6.5 Hz, 3H), 1.92 (s, 4H), 3.24 (s, 3H), 3.50 (d, J=12.7 Hz, 2H), 3.75 (s, 2H), 4.04 (d, J=12.7 Hz, 2H), 4.41 (q, J=6.5 Hz, 1H), 7.41 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.47 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.79 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
111		2－（3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル）－5－（1－メトキシエチル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール	357 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.50 (d, J=6.5 Hz, 3H), 1.72 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.87-2.94 (m, 1H), 3.25 (s, 3H), 3.97-4.00 (m, 2H), 4.02-4.07 (m, 4H), 4.43 (q, J=6.5 Hz, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
112		エチル 2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール－4－カルボキシレート	385 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.46 (t, J=7.2 Hz, 3H), 1.85-1.92 (m, 4H), 3.47-3.51 (m, 2H), 3.69 (s, 2H), 4.13 (d, J=12.0 Hz, 2H), 4.47 (q, J=7.2 Hz, 2H), 7.53 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.85-7.91 (m, 2H), 8.01 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
113		エチル 2－（3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール－4－カルボキシレート	371 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.47 (t, J=7.2 Hz, 3H), 1.66-1.68 (m, 1H), 2.84-2.89 (m, 1H), 3.93-3.94 (m, 2H), 4.04-4.14 (m, 4H), 4.49 (q, J=7.2 Hz, 2H), 7.55 (d, J=2.8 Hz, 1H), 7.88-7.94 (m, 2H), 8.02 (d, J=2.8 Hz, 1H)	$CDCl_3$

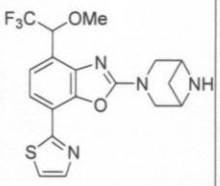
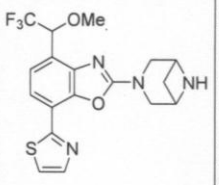
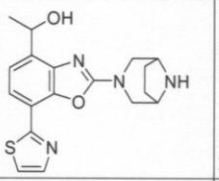
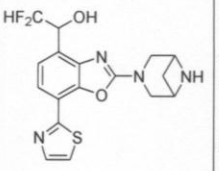
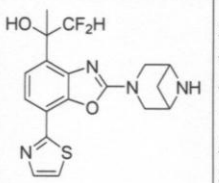
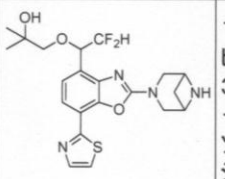
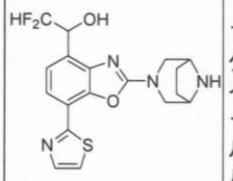
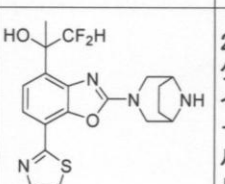
【０５６５】

【表１８】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
114		エチル 2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－カルボキシレート	399 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.47 (t, J=7.2 Hz, 3H), 1.60-1.65 (m, 1H), 1.93-1.95 (m, 4H), 2.05-2.11 (m, 1H), 3.30 (s, 2H), 3.65-3.69 (m, 2H), 4.34-4.37 (m, 2H), 4.49 (q, J=7.2 Hz, 2H), 7.55 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.86-7.92 (m, 2H), 8.02 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
115		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－N, N－ジメチル－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－カルボキシアミド	384 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.77-1.99 (m, 4H), 2.99 (s, 3H), 3.16 (s, 3H), 3.44 (dd, J=12.4, 1.7 Hz, 2H), 3.60-3.68 (m, 2H), 4.03 (dd, J=12.4, 2.0 Hz, 2H), 7.30 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.78 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.83 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	CD_3OD
116		(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)(モルホリノ)メタノン	426 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.79-1.97 (m, 4H), 3.37-3.42 (m, 2H), 3.44 (dd, J=12.4, 1.7 Hz, 2H), 3.62-3.67 (m, 2H), 3.67-3.73 (m, 2H), 3.80 (s, 4H), 4.02 (dd, J=12.4, 2.1 Hz, 2H), 7.33 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.77 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.83 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
117		(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)(ピペリジン－1－イル)メタノン	424 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.52-1.77 (m, 6H), 1.78-2.00 (m, 4H), 3.31-3.36 (m, 2H), 3.44 (dd, J=12.4, 1.8 Hz, 2H), 3.65 (dd, J=3.9, 2.1 Hz, 2H), 3.73-3.80 (m, 2H), 4.02 (dd, J=12.4, 2.0 Hz, 2H), 7.28 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.77 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.82 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
118		1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエタン－1－オール(光学活性体)	411 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.88 (d, J=1.5 Hz, 4H), 3.37-3.51 (m, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.00 (dd, J=12.1, 2.1 Hz, 2H), 5.12-5.25 (m, 1H), 7.20 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.48 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.85 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
119		1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエタン－1－オール(実施例118の鏡像異性体)	411 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.88 (d, J=1.5 Hz, 4H), 3.37-3.51 (m, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.00 (dd, J=12.1, 2.1 Hz, 2H), 5.12-5.25 (m, 1H), 7.20 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.48 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.85 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
120		1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエタン－1－オール(光学活性体)	397 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.1 Hz, 1H), 2.85-2.91 (m, 1H), 3.93-4.05 (m, 6H), 5.17-5.24 (m, 1H), 6.14 (brs, 1H), 7.23 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.50 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.88 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
121		1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエタン－1－オール(実施例120の鏡像異性体)	397 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.1 Hz, 1H), 2.85-2.91 (m, 1H), 3.93-4.05 (m, 6H), 5.17-5.24 (m, 1H), 6.14 (brs, 1H), 7.23 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.50 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.88 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$

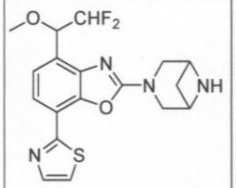
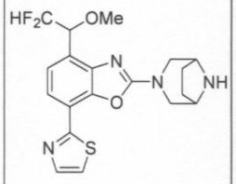
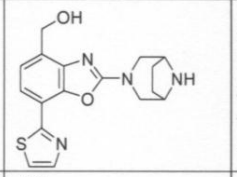
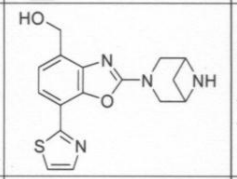
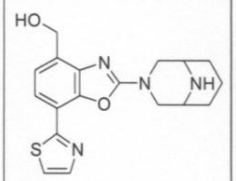
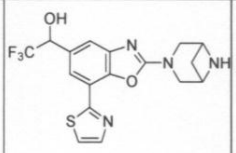
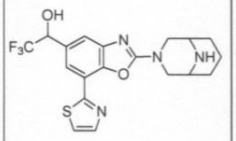
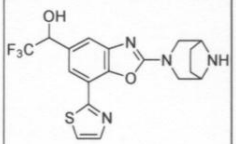
【０５６６】

【表１９】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
122		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(2, 2, 2－トリフルオロ－1－メトキシエチル)ベンゾ[d]オキサゾール(光学活性体)	411 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.82-2.91 (m, 1H), 3.46 (s, 3H), 3.92-4.06 (m, 6H), 5.34 (q, J=6.7 Hz, 1H), 7.47-7.49 (m, 2H), 7.92 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
123		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(2, 2, 2－トリフルオロ－1－メトキシエチル)ベンゾ[d]オキサゾール(実施例122の鏡像異性体)	411 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.82-2.91 (m, 1H), 3.46 (s, 3H), 3.92-4.06 (m, 6H), 5.34 (q, J=6.7 Hz, 1H), 7.47-7.49 (m, 2H), 7.92 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
124		1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)エタン－1－オール	357 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.63 (d, J=6.6 Hz, 3H), 1.89 (s, 4H), 3.43 (d, J=10.6 Hz, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.02 (d, J=10.6 Hz, 2H), 5.19 (brs, 1H), 7.15 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.44 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.80 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.94 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
125		1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－2, 2－ジフルオロエタン－1－オール	379 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.83-2.92 (m, 1H), 3.93 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.95-4.06 (m, 4H), 5.05 (td, J=11.4, 3.7 Hz, 1H), 5.89-6.22 (m, 1H), 7.24 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.48 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.87 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
126		2－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－1, 1－ジフルオロプロパン－2－オール	393 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 1.73 (s, 3H), 2.84-2.90 (m, 1H), 3.88-4.08 (m, 6H), 5.75-6.11 (m, 1H), 7.24-7.26 (m, 1H), 7.48 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.88 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
127		1－(1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－2, 2－ジフルオロエトキシ)－2－メチルプロパン－2－オール	451 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.15 (s, 3H), 1.27 (s, 3H), 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.85 (dt, J=9.3, 6.2 Hz, 1H), 3.35-3.51 (m, 2H), 3.92 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.95-4.06 (m, 4H), 4.97-5.03 (m, 1H), 6.03-6.36 (m, 1H), 7.30 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
128		1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－2, 2－ジフルオロエタン－1－オール	393 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.88 (s, 4H), 3.43 (ddd, J=12.2, 4.7, 2.0 Hz, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.00 (d, J=12.2 Hz, 2H), 5.02 (dt, J=11.2, 4.0 Hz, 1H), 5.84-6.23 (m, 1H), 7.21 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.84 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
129		2－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－1, 1－ジフルオロプロパン－2－オール	407 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.71 (s, 3H), 1.87 (d, J=1.7 Hz, 4H), 3.38-3.47 (m, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.00 (dt, J=12.4, 2.9 Hz, 2H), 5.72-6.08 (m, 1H), 7.23 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.85 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$

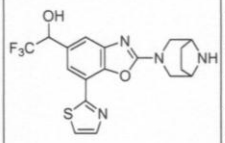
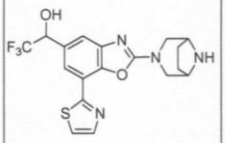
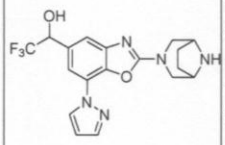
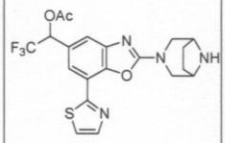
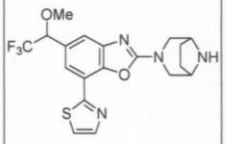
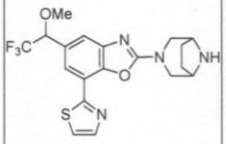
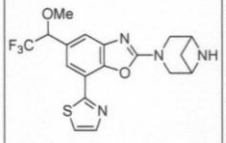
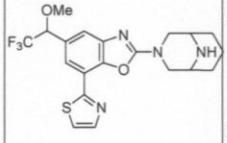
【０５６７】

【表２０】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ（ppm）	重溶媒
130		2－（3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル）－4－（2，2－ジフルオロ－1－メトキシエチル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール	393 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.68 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.81-2.91 (m, 1H), 3.45 (s, 3H), 3.92 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.95-4.07 (m, 4H), 4.91-5.02 (m, 1H), 6.04-6.38 (m, 1H), 7.36 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.91 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
131		2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－4－（2，2－ジフルオロ－1－メトキシエチル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール	407 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.85-1.91 (m, 4H), 3.39-3.42 (m, 2H), 3.44 (s, 3H), 3.68 (s, 2H), 4.03 (dt, J=12.5, 2.9 Hz, 2H), 4.93 (ddd, 12.5, 8.1, 4.3 Hz, 1H), 6.02-6.35 (m, 1H), 7.34 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.87 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
132		（2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル）メタノール	343 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.89 (s, 4H), 3.44 (d, J=12.2 Hz, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.02 (d, J=12.2 Hz, 2H), 4.96 (s, 2H), 7.17 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.46 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.80 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.94 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
133		（2－（3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル）メタノール	329 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.68 (d, J=9.4 Hz, 1H), 2.82-2.93 (m, 1H), 3.93 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 3.96-4.07 (m, 4H), 5.00 (s, 2H), 7.20 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.46 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.83 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
134		（2－（3，9－ジアザビシクロ[3．3．1]ノナン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル）メタノール	357 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.65-1.66 (m, 1H), 1.87-1.97 (m, 4H), 2.02-2.16 (m, 1H), 3.27 (s, 2H), 3.61 (dd, J=12.5, 3.8 Hz, 2H), 4.26 (d, J=12.5 Hz, 2H), 4.99 (s, 2H), 7.17 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.46 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.81 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
135		1－（2－（3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）－2，2，2－トリフルオロエタン－1－オール	397 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.70 (d, J=8.0 Hz, 1H), 2.85-2.89 (m, 1H), 3.92-4.01 (m, 6H), 5.10-5.15 (m, 1H), 7.48 (d, J=4.0 Hz, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.96-7.97 (m, 2H)	$CDCl_3$
136		1－（2－（3，9－ジアザビシクロ[3．3．1]ノナン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）－2，2，2－トリフルオロエタン－1－オール	425 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.61-1.65 (m, 1H), 1.91-1.94 (m, 4H), 2.04 (s, 1H), 3.30 (s, 2H), 3.57-3.61 (m, 2H), 4.25 (d, J=12.6 Hz, 2H), 5.15 (q, J=6.8 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.97-7.98 (m, 2H)	$CDCl_3$
137		1－（2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）－2，2，2－トリフルオロエタン－1－オール（ラセミ体）	411 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.88 (s, 4H), 3.35-3.49 (m, 2H), 3.68 (s, 2H), 3.91-4.01 (m, 2H), 5.11 (q, J=6.7 Hz, 1H), 7.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.95 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$

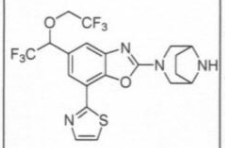
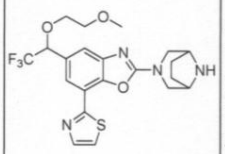
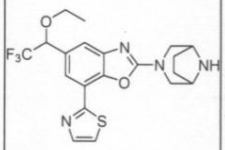
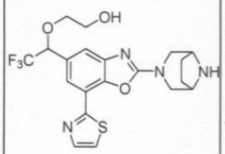
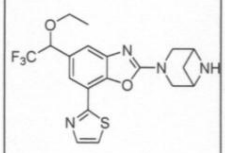
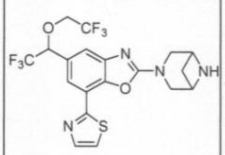
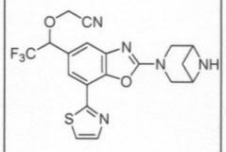
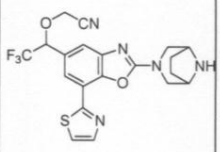
【０５６８】

【表２１】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
138		1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエタン－1－オール(光学活性体)	411 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.88 (s, 4H), 3.35-3.49 (m, 2H), 3.68 (s, 2H), 3.91-4.01 (m, 2H), 5.11 (q, J=6.7 Hz, 1H), 7.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.95-7.96 (m, 2H)	$CDCl_3$
139		1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエタン－1－オール(実施例138の鏡像異性体)	411 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.88 (s, 4H), 3.35-3.49 (m, 2H), 3.68 (s, 2H), 3.91-4.01 (m, 2H), 5.11 (q, J=6.7 Hz, 1H), 7.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.95-7.96 (m, 2H)	$CDCl_3$
140		1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(1H－ピラゾール－1－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエタン－1－オール	394 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.87 (s, 4H), 3.39 (t, J=9.9 Hz, 2H), 3.67 (s, 2H), 3.91 (d, J=12.1 Hz, 2H), 5.11 (q, J=6.8 Hz, 1H), 6.53 (dd, J=2.5, 1.8 Hz, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.70-7.80 (m, 2H), 8.18 (d, J=2.1 Hz, 1H)	$CDCl_3$
141		1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエチルアセテート	453 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.88 (s, 4H), 2.20 (s, 3H), 3.45 (d, J=12.1 Hz, 2H), 3.69 (s, 2H), 4.01 (dd, J=12.1, 1.9 Hz, 2H), 6.24 (q, J=6.8 Hz, 1H), 7.49-7.50 (m, 2H), 7.98-7.99 (m, 2H)	$CDCl_3$
142		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(2, 2, 2－トリフルオロ－1－メトキシエチル)ベンゾ[d]オキサゾール(光学活性体)	425 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89 (d, J=1.8 Hz, 4H), 3.39-3.49 (m, 5H), 3.69 (s, 2H), 4.02 (d, J=11.4 Hz, 2H), 4.61 (q, J=6.6 Hz, 1H), 7.48-7.53 (m, 2H), 7.91 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
143		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(2, 2, 2－トリフルオロ－1－メトキシエチル)ベンゾ[d]オキサゾール(実施例142の鏡像異性体)	425 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89 (d, J=1.8 Hz, 4H), 3.39-3.49 (m, 5H), 3.69 (s, 2H), 4.02 (d, J=11.4 Hz, 2H), 4.61 (q, J=6.6 Hz, 1H), 7.48-7.53 (m, 2H), 7.91 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
144		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(2, 2, 2－トリフルオロ－1－メトキシエチル)ベンゾ[d]オキサゾール	411 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.79-2.93 (m, 1H), 3.45 (s, 3H), 3.88-4.08 (m, 6H), 4.63 (q, J=6.5 Hz, 1H), 7.47-7.52 (m, 1H), 7.56 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.99 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
145		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(2, 2, 2－トリフルオロ－1－メトキシエチル)ベンゾ[d]オキサゾール	439 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.59-1.70 (m, 1H), 1.86-1.97 (m, 4H), 1.99-2.15 (m, 1H), 3.28 (s, 2H), 3.43 (s, 3H), 3.63 (dd, J=12.7, 3.9 Hz, 2H), 4.27 (d, J=12.7 Hz, 2H), 4.62 (q, J=6.5 Hz, 1H), 7.47-7.55 (m, 2H), 7.92 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$

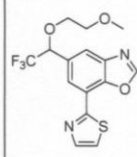
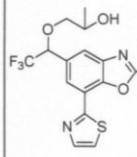
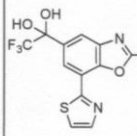
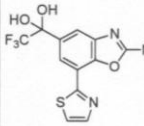
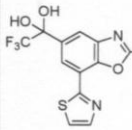
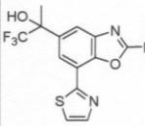
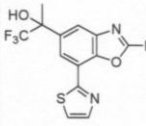
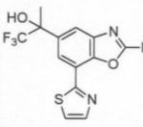
【０５６９】

【表２２】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
146		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(2, 2, 2－トリフルオロ－1－(2, 2, 2－トリフルオロエトキシ)エチル)ベンゾ[d]オキサゾール	493 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89 (s, 4H), 3.45-3.48 (m, 2H), 3.70 (brs, 2H), 3.78-3.96 (m, 2H), 4.02 (q, J=12.0 Hz, 2H), 4.89 (q, J=6.2 Hz, 1H), 7.47-7.55 (m, 2H), 7.91 (s, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
147		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(2, 2, 2－トリフルオロ－1－(2－メトキシエトキシ)エチル)ベンゾ[d]オキサゾール	469 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.60-1.68 (m, 2H), 2.05-2.09 (m, 2H), 3.36 (s, 3H), 3.55-3.64 (m, 2H), 3.68-3.74 (m, 2H), 3.81 (brd, J=14.2 Hz, 2H), 4.08 (brs, 2H), 4.19 (d, J=14.2 Hz, 2H), 4.83-4.92 (m, 1H), 7.50 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
148		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－(1－エトキシ－2, 2, 2－トリフルオロエチル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	439 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.22-1.29 (m, 3H), 1.91 (s, 4H), 3.49 (d, J=11.0 Hz, 2H), 3.54-3.64 (m, 2H), 3.73 (brs, 2H), 4.03 (d, J=11.0 Hz, 2H), 4.71 (q, J=6.5 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
149		2－(1－(2－(3. 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエトキシ)エタン－1－オール	455 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89 (s, 4H), 3.42-3.50 (m, 2H), 3.64-3.69 (m, 2H), 3.70-3.74 (m, 2H), 3.75-3.81 (m, 2H), 4.02 (d, J=11.9 Hz, 2H), 4.74-4.83 (m, 1H), 7.47-7.54 (m, 2H), 7.93 (s, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
150		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－5－(1－エトキシ－2, 2, 2－トリフルオロエチル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	425 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.26 (t, J=7.0 Hz, 3H), 1.72 (m, 1H), 2.98 (d, J=9.4 Hz, 1H), 3.60 (qd, J=7.0, 2.5 Hz, 2H), 4.05-4.12 (m, 6H), 4.70-4.77 (m, 1H), 7.50 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
151		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(2, 2, 2－トリフルオロ－1－(2, 2, 2－トリフルオロエトキシ)エチル)ベンゾ[d]オキサゾール	479 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.71 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.91 (d, J=9.2 Hz, 1H), 3.86-3.95 (m, 2H), 3.98 (d, J=6.5 Hz, 2H), 4.01-4.06 (m, 4H), 4.91 (m, 1H), 7.52 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.99 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
152		2－(1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエトキシ)アセトニトリル	436 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.70 (d, J=9.4 Hz, 1H), 2.86-2.92 (m, 1H), 3.96 (d, J=6.2 Hz, 2H), 4.00-4.08 (m, 4H), 4.19-4.25 (m, 1H), 4.43-4.49 (m, 1H), 4.95-4.98 (m, 1H), 7.51-7.54 (m, 2H), 7.98 (s, 1H), 8.00 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
153		2－(1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエトキシ)アセトニトリル	450 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89-1.94 (m, 4H), 3.54 (d, J=12.0 Hz, 2H), 3.77 (s, 2H), 4.05 (d, J=12.0 Hz, 2H), 4.16-4.24 (m, 1H), 4.41-4.47 (m, 1H), 4.90-4.98 (m, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.52 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.99 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$

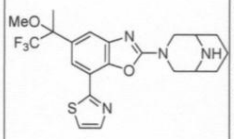
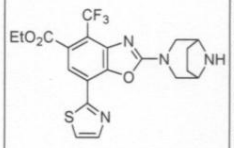
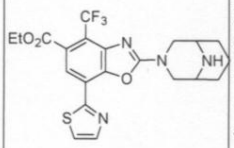
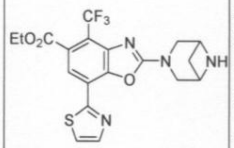
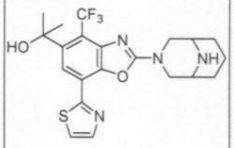
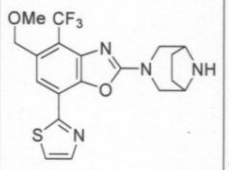
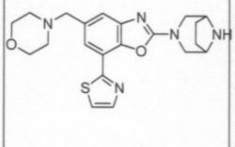
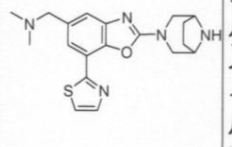
【０５７０】

【表２３】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ（ppm）	重溶媒
154		2－（3，6－ジアザビシクロ［3．1．1］ヘプタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－5－（2，2，2－トリフルオロ－1－（2－メトキシエトキシ）エチル）ベンゾ［d］オキサゾール	455 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.59 (d, J=8.9 Hz, 1H), 2.55–2.61 (m, 1H), 3.23 (s, 3H), 3.45–3.54 (m, 2H), 3.60–3.68 (m, 2H), 3.70–3.75 (m, 2H), 3.82–4.00 (m, 4H), 5.33–5.36 (m, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.06 (d, J=3.3 Hz, 1H)	DMSO-d_6
155		1－（1－（2－（3，8－ジアザビシクロ［3．2．1］オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ［d］オキサゾール－5－イル）－2，2，2－トリフルオロエトキシ）プロパン－2－オール	469 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.05–1.08 (m, 3H), 1.77–1.84 (m, 4H), 3.30–3.42 (m, 4H), 3.53–3.59 (m, 2H), 3.82–3.92 (m, 3H), 4.87 (q, J=6.6 Hz, 1H), 7.38–7.42 (m, 1H), 7.69 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.82–7.85 (m, 1H), 7.89 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
156		1－（2－（3，9－ジアザビシクロ［3．3．1］ノナン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ［d］オキサゾール－5－イル）－2，2，2－トリフルオロエタン－1，1－ジオール	441 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.62–1.68 (m, 1H), 1.91–1.94 (m, 4H), 2.02–2.09 (m, 1H), 3.29 (brs, 2H), 3.61–3.69 (m, 2H), 4.25–4.29 (m, 2H), 7.49 (d, J=3.3 Hz, 0.6H), 7.54 (d, J=3.3 Hz, 0.4H), 7.68 (s, 0.6H), 7.99 (d, J=3.3 Hz, 0.6H), 8.03 (d, J=3.3 Hz, 0.4H), 8.07 (s, 0.4H), 8.22 (s, 0.6H), 8.66 (s, 0.4H)	$CDCl_3$
157		1－（2－（3，8－ジアザビシクロ［3．2．1］オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ［d］オキサゾール－5－イル）－2，2，2－トリフルオロエタン－1，1－ジオール	427 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.89 (s, 4H), 3.30 (s, 1H), 3.44–3.50 (m, 3H), 3.71 (brs, 2H), 4.01–4.04 (m, 2H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 0.5H), 7.53 (d, J=3.3 Hz, 0.5H), 7.66 (s, 0.5H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 0.5H), 8.02 (d, J=3.3 Hz, 0.5H), 8.06 (s, 0.5H), 8.20 (d, J=1.7 Hz, 0.5H), 8.66 (d, J=1.7 Hz, 0.5H)	$CDCl_3$
158		1－（2－（3，6－ジアザビシクロ［3．1．1］ヘプタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ［d］オキサゾール－5－イル）－2，2，2－トリフルオロエタン－1，1－ジオール	413 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.71 (d, J=9.5 Hz, 1H), 2.85–2.94 (m, 1H), 3.49 (brs, 2H), 3.95 (d, J=6.0 Hz, 2H), 4.04–4.12 (m, 4H), 7.55 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.03 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.69 (s, 1H)	$CDCl_3$
159		2－（2－（3，8－ジアザビシクロ［3．2．1］オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ［d］オキサゾール－5－イル）－1，1，1－トリフルオロプロパン－2－オール	425 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.83–1.88 (m, 7H), 3.43 (dd, J=12.2, 2.0 Hz, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.00 (dd, J=12.2, 2.0 Hz, 2H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.64 (d, J=1.5 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.12 (d, J=1.5 Hz, 1H)	$CDCl_3$
160		2－（2－（3，6－ジアザビシクロ［3．1．1］ヘプタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ［d］オキサゾール－5－イル）－1，1，1－トリフルオロプロパン－2－オール	411 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.69 (d, J=9.2 Hz, 1H), 1.88 (s, 3H), 2.83–2.91 (m, 1H), 3.93–4.04 (m, 6H), 7.49 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H)	$CDCl_3$
161		2－（2－（3，9－ジアザビシクロ［3．3．1］ノナン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ［d］オキサゾール－5－イル）－1，1，1－トリフルオロプロパン－2－オール	439 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.62–1.67 (m, 1H), 1.87 (s, 3H), 1.90–1.98 (m, 4H), 2.02–2.10 (m, 1H), 2.62 (s, 1H), 3.30 (s, 2H), 3.64 (dd, J=13.1, 3.6 Hz, 2H), 4.27 (d, J=13.1 Hz, 2H), 7.49 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.13 (d, J=1.6 Hz, 1H)	$CDCl_3$

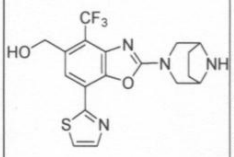
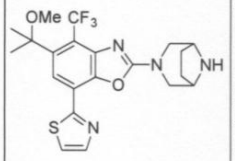
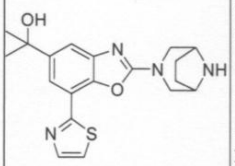
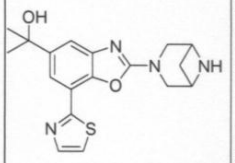
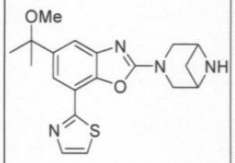
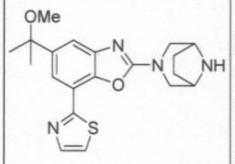
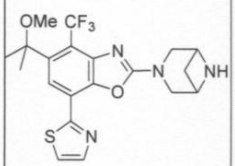
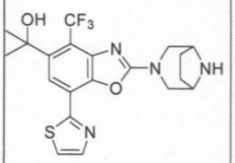
【０５７１】

【表２４】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
162		2－(2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(1, 1, 1－トリフルオロ－2－メトキシプロパン－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	453 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.60–1.69 (m, 1H), 1.87 (s, 3H), 1.90–1.98 (m, 4H), 2.00–2.15 (m, 1H), 3.27 (s, 5H), 3.63 (dd, J=12.7, 3.8 Hz, 2H), 4.27 (d, J=12.7 Hz, 2H), 7.49 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.63 (s, 1H), 7.92–8.03 (m, 2H)	$CDCl_3$
163		エチル 2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	453 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.41 (t, J=7.6 Hz, 3H), 1.93 (d, J=8.8 Hz, 4H), 3.55–3.58 (m, 2H), 3.77 (s, 2H), 4.09–4.12 (m, 2H), 4.43 (q, J=7.6 Hz, 2H), 7.56 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.02 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H)	$CDCl_3$
164		エチル 2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	467 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.42 (t, J=7.2 Hz, 3H), 1.60–1.68 (m, 1H), 1.94–2.00 (m, 4H), 2.02–2.09 (m, 1H), 3.33 (s, 2H), 3.68–3.71 (m, 2H), 4.31–4.34 (m, 2H), 4.43 (q, J=7.2 Hz, 2H), 7.57 (d, J=3.6 Hz, 1H), 8.02 (d, J=3.6 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H)	$CDCl_3$
165		エチル 2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	439 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.41 (t, J=7.1 Hz, 3H), 1.70 (d, J=9.4 Hz, 1H), 2.85–2.91 (m, 1H), 3.93 (d, J=5.8 Hz, 2H), 3.99–4.11 (m, 4H), 4.42 (q, J=7.1 Hz, 2H), 7.57 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.02 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H)	$CDCl_3$
166		2－(2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)プロパン－2－オール	453 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.60–1.69 (m, 1H), 1.80 (s, 6H), 1.89–1.98 (m, 4H), 2.03–2.10 (m, 1H), 2.17–2.18 (m, 1H), 3.27 (s, 2H), 3.62 (dd, J=13.0, 3.7 Hz, 2H), 4.30 (d, J=13.0 Hz, 2H), 7.54 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.20 (s, 1H)	$CDCl_3$
167		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－(メトキシメチル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	425 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89 (m, 4H), 3.45–3.48 (m, 5H), 3.69 (s, 2H), 4.05–4.08 (m, 2H), 4.70 (d, J=0.73 Hz, 2H), 7.52 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.07 (s, 1H)	$CDCl_3$
168		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－(モルホリノメチル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	412 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69–1.91 (m, 4H), 2.30–2.47 (m, 4H), 3.35 (dd, J=12.4, 1.9 Hz, 2H), 3.51 (s, 2H), 3.55–3.65 (m, 6H), 3.88 (dd, J=12.4, 2.0 Hz, 2H), 7.27 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.64 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.66 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.86 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
169		1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－N, N－ジメチルメタンアミン	370 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.79–2.00 (m, 4H), 2.35 (s, 6H), 3.44 (dd, J=12.4, 1.9 Hz, 2H), 3.64–3.72 (m, 2H), 3.68 (s, 2H), 3.98 (dd, J=12.3, 2.0 Hz, 2H), 7.37 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.75 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.76 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD

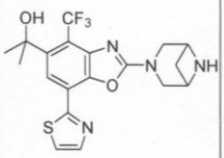
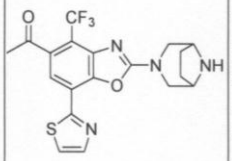
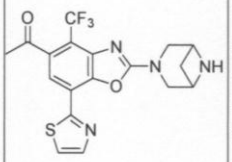
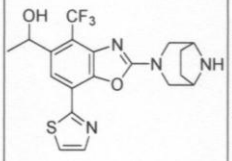
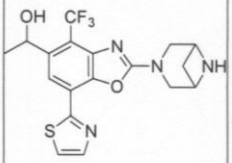
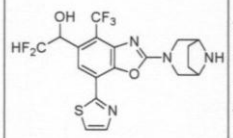
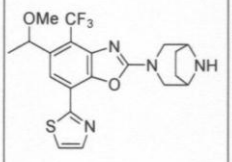
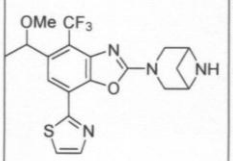
【０５７２】

【表２５】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ（ppm）	重溶媒
170		（2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメチル）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）メタノール	411 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.90 (m, 4H), 3.46 (dd, J=12.3, 1.9 Hz, 2H), 3.69 (s, 2H), 4.03–4.10 (m, 2H), 4.94 (d, J=0.73 Hz, 2H), 7.53 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.00 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.10 (d, J=0.73 Hz, 1H)	$CDCl_3$
171		2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－5－（2－メトキシプロパン－2－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメチル）ベンゾ[d]オキサゾール	453 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.75 (s, 6H), 1.90 (m, 4H), 3.14 (s, 3H), 3.45–3.50 (m, 2H), 3.71 (s, 2H), 4.08 (d, J=12.4 Hz, 2H), 7.53 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.03 (s, 1H)	$CDCl_3$
172		2－（2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）プロパン－2－オール	371 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.60 (s, 6H), 1.81–1.99 (m, 4H), 3.43 (dd, J=12.3, 2.0 Hz, 2H), 3.62–3.69 (m, 2H), 3.96 (dd, J=12.3, 2.1 Hz, 2H), 7.54 (d, J=1.7 Hz, 1H), 7.73 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J=1.7 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
173		2－（2－（3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）プロパン－2－オール	357 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.64 (s, 6H), 1.81 (d, J=9.4 Hz, 1H), 2.87 (dt, J=9.4, 6.4 Hz, 1H), 3.90–4.08 (m, 6H), 7.60 (d, J=1.7 Hz, 1H), 7.74 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.99 (d, J=1.7 Hz, 1H)	CD_3OD
174		（2－（3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル）－5－（2－メトキシプロパン－2－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール	371 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.62 (s, 6H), 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.83–2.90 (m, 1H), 3.11 (s, 3H), 3.91–3.98 (m, 2H), 4.00–4.06 (m, 4H), 7.47 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.97(d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
175		（2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－5－（2－メトキシプロパン－2－イル）－7－（チアゾール－2－イル）ベンゾ[d]オキサゾール	385 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.61 (s, 6H), 1.88–1.92 (m, 4H), 3.10 (s, 3H), 3.46 (d, J=12.2 Hz, 2H), 3.71 (s, 2H), 4.02 (d, J=12.2 Hz, 2H), 7.46 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
176		2－（3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル）－5－（2－メトキシプロパン－2－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメチル）ベンゾ[d]オキサゾール	439 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 1.76 (s, 6H), 2.85–2.90 (m, 1H), 3.15 (s, 3H), 3.94 (d, J=6.1 Hz, 2H), 4.00–4.09 (m, 4H), 7.54 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.02 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.07 (s, 1H)	$CDCl_3$
177		2－（2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメチル）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）プロパン－2－オール	439 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.79 (s, 6H), 1.88 (s, 4H), 3.45 (dd, J=12.2, 2.0 Hz, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.05–4.08 (m, 2H), 7.53 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.00 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.20 (s, 1H)	$CDCl_3$

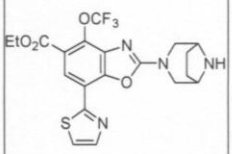
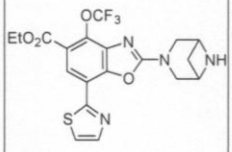
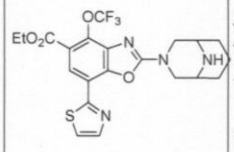
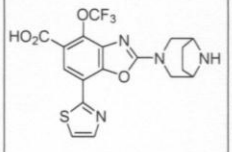
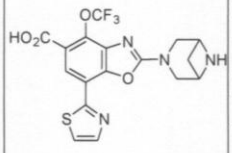
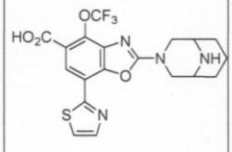
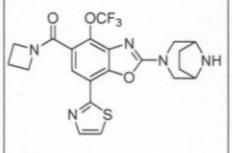
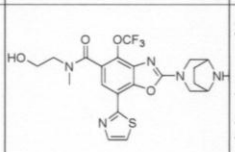
【０５７３】

【表２６】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
178		2－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)プロパン－2－オール	425 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 1.81 (s, 6H), 2.84-2.89 (m, 1H), 3.93 (d, J=6.1 Hz, 2H), 3.99-4.08 (m, 4H), 7.54 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.24 (s, 1H)	$CDCl_3$
179		1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)エタン－1－オン	423 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89 (s, 4H), 2.62 (s, 3H), 3.49 (d, J=12.4 Hz, 2H), 3.70 (s, 2H), 4.08 (d, J=12.4 Hz, 2H), 7.56 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.83 (s, 1H), 8.01 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
180		1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)エタン－1－オン	409 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.64 (s, 3H), 2.86-2.92 (m, 1H), 3.94 (d, J=5.9 Hz, 2H), 4.02-4.10 (m, 4H), 7.58 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.87 (s, 1H), 8.02 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
181		1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)エタン－1－オール	425 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.57 (s, 3H), 1.88 (s, 4H), 3.44-3.47 (m, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.06 (d, J=12.0 Hz, 2H), 5.37-5.45 (m, 1H), 7.53 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.02 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.28 (s, 1H)	$CDCl_3$
182		1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)エタン－1－オール	411 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.57 (d, J=6.2 Hz, 3H), 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.84-2.90 (m, 1H), 3.49 (s, 1H), 3.93 (d, J=6.1 Hz, 2H), 4.00-4.07 (m, 4H), 5.43-5.48 (m, 1H), 7.54 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.02 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.31 (s, 1H)	$CDCl_3$
183		1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－2, 2－ジフルオロエタン－1－オール	461 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.60-1.83 (m, 4H), 3.37-3.46 (m, 2H), 3.56 (s, 2H), 3.87 (d, J=12.2 Hz, 2H), 5.11-5.30 (m, 1H), 5.86-6.27 (m, 1H), 6.63 (d, J=5.3 Hz, 1H), 8.06 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.12 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.17 (s, 1H)	DMSO-d_6
184		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－(1－メトキシエチル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	439 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.49 (d, J=6.2 Hz, 3H), 1.88 (d, J=1.6 Hz, 4H), 3.23 (s, 3H), 3.46 (dd, J=12.4, 2.1 Hz, 2H), 3.69 (s, 2H), 4.05-4.08 (m, 2H),4.80-4.85 (m, 1H), 7.53 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.02 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H)	$CDCl_3$
185		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－5－(1－メトキシエチル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール	425 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.51 (d, J=6.2 Hz, 3H), 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.85-2.91 (m, 1H), 3.24 (s, 3H), 3.95 (d, J=5.9 Hz, 2H), 4.00-4.09 (m, 4H), 4.85-4.89 (m, 1H), 7.54 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.03 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H)	$CDCl_3$

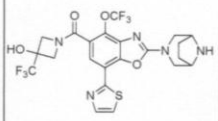
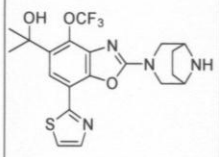
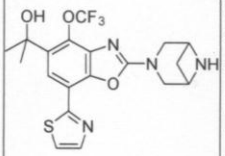
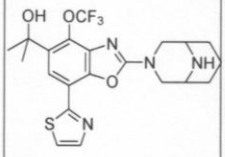
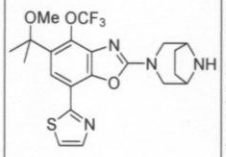
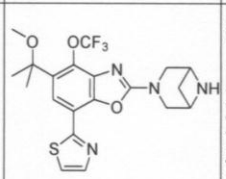
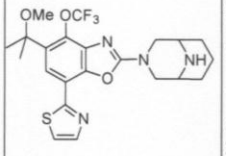
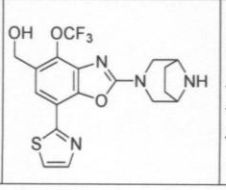
【０５７４】

【表２７】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ（ppm）	重溶媒
186		エチル　2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	469 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.42 (t, J=7.2 Hz, 3H), 1.89 (s, 4H), 3.45-3.49 (m, 2H), 3.69 (s, 2H), 4.05 (d, J=10.4 Hz, 2H), 4.43 (q, J=7.2 Hz, 2H), 7.51 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.99 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.45 (s, 1H)	$CDCl_3$
187		エチル　2－（3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	455 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.42 (t, J=7.2 Hz, 3H), 1.70 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.85-2.90 (m, 1H), 3.93 (s, 2H), 4.00-4.07 (m, 4H), 4.44 (q, J=7.2 Hz, 2H), 7.52 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.00 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.48 (s, 1H)	$CDCl_3$
188		エチル　2－（3，9－ジアザビシクロ[3．3．1]ノナン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキシレート	483 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.42 (t, J=7.2 Hz, 3H), 1.63-1.66 (m, 1H), 1.91-1.93 (m, 4H), 1.98-2.07 (m, 1H), 3.28 (s, 2H), 3.64 (dd, J=12.8, 4.0 Hz, 2H), 4.29 (d, J=12.8 Hz, 2H), 4.43 (q, J=7.2 Hz, 2H), 7.51 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.00 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.45 (s, 1H)	$CDCl_3$
189		2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボン酸	441 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.70-1.77 (m, 4H), 3.40-3.43 (m, 2H), 3.64 (s, 2H), 3.86-3.89 (m, 2H), 8.00 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.08 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.23 (s, 1H)	DMSO-d_6
190		2－（3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボン酸	427 $(M+H)^+$	(400 MHz)：2.26-2.29 (m, 1H), 3.52 (d, J=5.2 Hz, 1H), 4.54-4.58 (m, 2H), 4.69-4.72 (m, 2H), 4.91 (d, J=6.0 Hz, 2H), 8.27 (d, J=3.6 Hz, 1H), 8.43 (d, J=3.6 Hz, 1H), 8.72 (s, 1H)	TFA-d
191		2－（3，9－ジアザビシクロ[3．3．1]ノナン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボン酸	455 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.52 (s, 1H), 1.84-1.88 (m, 5H), 3.21-3.28 (m, 2H), 3.62-3.65 (m, 2H), 4.12-4.15 (m, 2H), 8.02 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.09 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.24 (s, 1H)	DMSO-d_6
192		(2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）（アゼチジン－1－イル）メタノン	480 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.76-2.00 (m, 4H), 2.36 (quin, J=7.8 Hz, 2H), 3.47 (dd, J=12.4, 1.7 Hz, 2H), 3.63-3.69 (m, 2H), 4.04 (dd, J=12.4, 2.0 Hz, 2H), 4.12 (t, J=7.8 Hz, 2H), 4.21 (t, J=7.8 Hz, 2H), 7.80 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.99 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
193		2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－N－（2－ヒドロキシエチル）－N－メチル－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－5－カルボキサミド	498 $(M+H)^+$	(400 MHz, 90 °C)：1.64-1.86 (m, 4H), 2.95 (brs, 3H), 3.13-3.34 (m, 1H), 3.41 (dd, J=11.8, 1.7 Hz, 2H), 3.44-3.76 (m, 5H), 3.88 (dd, J=11.8, 1.3 Hz, 2H), 4.40 (brs, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.92 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.03 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6

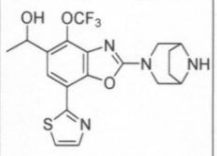
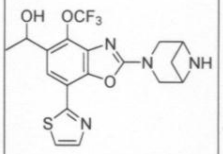
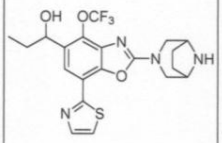
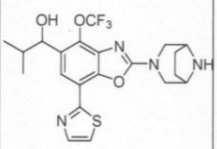
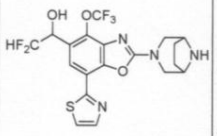
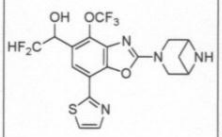
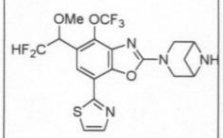
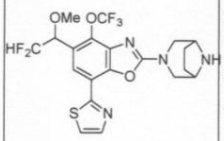
【０５７５】

【表２８】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
194		(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)(3－ヒドロキシ－3－(トリフルオロメチル)アゼチジン－1－イル)メタノン	564 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.79–2.01 (m, 4H), 3.48 (dd, J=12.4, 1.6 Hz, 2H), 3.62–3.70 (m, 2H), 4.03 (dd, J=12.4, 1.9 Hz, 2H), 4.10 (m, 2H), 4.35 (dd, J=10.3, 1.1 Hz, 1H), 4.41 (dd, J=11.3, 1.2 Hz, 1H), 7.81 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.91 (s, 1H), 8.00 (d, J=3.2 Hz, 1H)	CD_3OD
195		2－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)プロパン－2－オール	455 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.72 (s, 6H), 1.83–1.92 (m, 4H), 3.43 (dd, J=12.3, 1.9 Hz, 2H), 3.67 (s, 2H), 4.02 (dd, J=12.3, 1.9 Hz, 2H), 7.46 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H)	$CDCl_3$
196		2－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)プロパン－2－オール	441 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.2 Hz, 1H), 1.74 (s, 6H), 2.82–2.90 (m, 1H), 3.92 (d, J=6.2 Hz, 2H), 3.96–4.05 (m, 4H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.18 (s, 1H)	$CDCl_3$
197		2－(2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)プロパン－2－オール	469 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.61–1.65 (m, 1H), 1.73 (s, 6H), 1.92–1.94 (m, 4H), 1.97–2.10 (m, 1H), 3.28 (s, 2H), 3.62 (dd, J=12.8, 4.0 Hz, 2H), 4.27 (d, J=12.8 Hz, 2H), 7.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H)	$CDCl_3$
198		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－(2－メトキシプロパン－2－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	469 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (s, 6H), 1.89 (d, J=1.6 Hz, 4H), 3.16 (s, 3H), 3.45 (dd, J=12.2, 1.8 Hz, 2H), 3.69 (s, 2H), 4.04 (dd, J=12.2, 1.8 Hz, 2H), 7.47 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.96–7.98 (m, 2H)	$CDCl_3$
199		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－5－(2－メトキシプロパン－2－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	455 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 1.71 (s, 6H), 2.84–2.89 (m, 1H), 3.17 (s, 3H), 3.92 (d, J=6.1 Hz, 2H), 3.96–4.05 (m, 4H), 7.48 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.02 (s, 1H)	$CDCl_3$
200		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－5－(2－メトキシプロパン－2－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	483 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.61–1.65 (m, 1H), 1.70 (s, 6H), 1.93–1.95 (m, 4H), 1.99–2.12 (m, 1H), 3.17 (s, 3H), 3.30 (s, 2H), 3.64 (dd, J=12.5, 3.4 Hz, 2H), 4.28 (d, J=12.5 Hz, 2H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.99 (s, 1H)	$CDCl_3$
201		(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)メタノール	427 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.92 (s, 4H), 3.51 (d, J=13.1 Hz, 2H), 3.73 (s, 2H), 4.06 (d, J=10.3 Hz, 2H), 4.87 (s, 2H), 7.49 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.00 (s, 1H)	$CDCl_3$

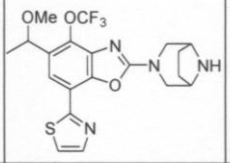
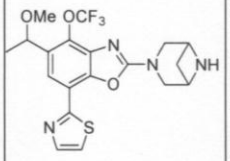
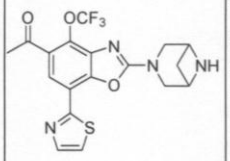
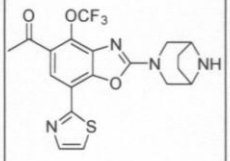
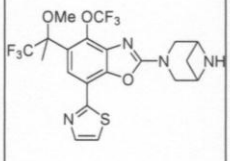
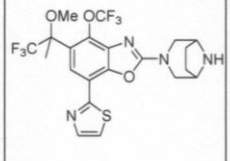
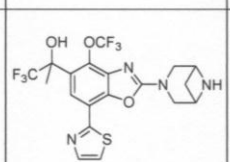
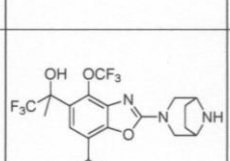
【０５７６】

【表２９】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ（ppm）	重溶媒
202		1－（2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）エタン－1－オール	441 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.55-1.58 (m, 3H), 1.88 (d, J=1.5 Hz, 4H), 3.44 (d, J=12.2 Hz, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.03 (d, J=12.2 Hz, 2H), 5.36 (q, J=6.5 Hz, 1H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H)	$CDCl_3$
203		1－（2－（3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）エタン－1－オール	427 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.56 (d, J=6.4 Hz, 3H), 1.69 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.81-2.99 (m, 1H), 3.86-4.02 (m, 6H), 5.38 (q, J=6.4 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H)	CD_3OD
204		1－（2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）プロパン－1－オール	455 $(M+H)^+$	(400 MHz)：0.97 (t, J=7.4 Hz, 3H), 1.68-2.01 (m, 6H), 3.46 (dd, J=12.5, 1.8 Hz, 2H), 3.66-3.72 (m, 2H), 4.00-4.08 (m, 2H), 5.01 (dd, J=7.5, 5.4 Hz, 1H), 7.76 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.02 (s, 1H)	CD_3OD
205		1－（2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）－2－メチルプロパン－1－オール	469 $(M+H)^+$	(400 MHz)：0.82 (d, J=6.7 Hz, 3H), 1.04 (d, J=6.7 Hz, 3H), 1.85-2.09 (m, 5H), 3.50 (dd, J=12.7, 1.7 Hz, 2H), 3.75-3.85 (m, 2H), 4.09 (ddd, J=12.7, 4.2, 2.0 Hz, 2H), 4.78 (d, J=7.2 Hz, 1H), 7.77 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.99 (s, 1H)	CD_3OD
206		1－（2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）－2，2－ジフルオロエタン－1－オール	477 (M+H)+	(400 MHz)：1.61-1.80 (m, 4H), 3.35-3.46 (m, 2H), 3.55 (s, 2H), 3.84 (d, J=12.0 Hz, 2H), 5.03-5.17 (m, 1H), 5.95-6.31 (m, 1H), 6.58 (d, J=5.4 Hz, 1H), 7.99 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.01 (s, 1H), 8.07 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6
207		1－（2－（3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル）－2，2－ジフルオロエタン－1－オール	463 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.60 (d, J=8.8 Hz, 1H), 2.54-2.62 (m, 1H), 3.70 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.88 (brs, 4H), 5.04-5.21 (m, 1H), 5.93-6.33 (m, 1H), 6.59 (d, J=5.4 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.04 (s, 1H), 8.08 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6
208		2－（3，6－ジアザビシクロ[3．1．1]ヘプタン－3－イル）－5－（2，2－ジフルオロ－1－メトキシエチル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール	477 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.68 (d, J=9.1 Hz, 1H), 2.87 (dt, J=9.1, 6.3 Hz, 1H), 3.41 (s, 3H), 3.93 (d, J=6.1 Hz, 2H), 3.96-4.08 (m, 4H), 4.82-4.96 (m, 1H), 5.71-6.08 (m, 1H), 7.51 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.99 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.03 (s, 1H)	$CDCl_3$
209		2－（3，8－ジアザビシクロ[3．2．1]オクタン－3－イル）－5－（2，2－ジフルオロ－1－メトキシエチル）－7－（チアゾール－2－イル）－4－（トリフルオロメトキシ）ベンゾ[d]オキサゾール	491 $(M+H)^+$	(400 MHz)：1.88 (s, 4H), 3.39 (s, 3H), 3.45 (d, J=12.2 Hz, 2H), 3.69 (s, 2H), 3.98-4.11 (m, 2H), 4.82-4.94 (m, 1H), 5.70-6.06 (m, 1H), 7.50 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.96-8.00 (m, 2H)	$CDCl_3$

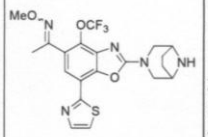
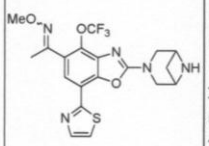
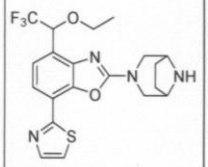
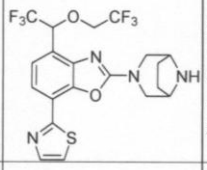
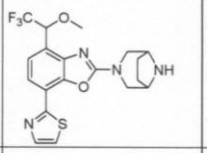
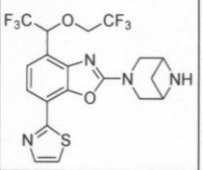
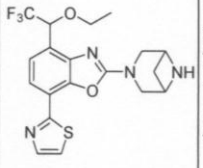
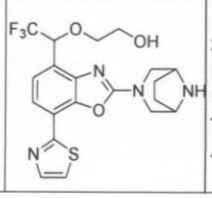
【０５７７】

【表３０】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
210		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－(1－メトキシエチル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	455 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.48 (d, J=6.5 Hz, 3H), 1.91 (s, 4H), 3.24 (s, 3H), 3.50 (d, J=11.3 Hz, 2H), 3.73 (s, 2H), 4.06 (d, J=11.3 Hz, 2H), 4.81 (q, J=6.5 Hz, 1H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.97-7.98 (m, 2H)	$CDCl_3$
211		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－5－(1－メトキシエチル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	441 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.50 (d, J=6.4 Hz, 3H), 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.84-2.89 (m, 1H), 3.25 (s, 3H), 3.92 (d, J=5.9 Hz, 2H), 3.98-4.06 (m, 4H), 4.83 (q, J=6.4 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.99 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.01 (s, 1H)	$CDCl_3$
212		1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)エタン－1－オン	425 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.70 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.69 (s, 3H), 2.83-2.91 (m, 1H), 3.94 (d, J=6.4 Hz, 2H), 3.98-4.07 (m, 4H), 7.52 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.00 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.24 (s, 1H)	$CDCl_3$
213		1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)エタン－1－オン	439 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.90 (brs, 4H), 2.67 (s, 3H), 3.49 (d, J=11.9 Hz, 2H), 3.72 (brs, 2H), 4.06 (d, J=11.9 Hz, 2H), 7.51 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.20 (s, 1H)	$CDCl_3$
214		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(1, 1, 1－トリフルオロ－2－メトキシプロパン－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	509 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 1.99 (s, 3H), 2.84-2.89 (m, 1H), 3.33 (s, 3H), 3.92 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.96-4.05 (m, 4H), 7.49 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.99 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.21 (s, 1H)	$CDCl_3$
215		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－5－(1, 1, 1－トリフルオロ－2－メトキシプロパン－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	523 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.87 (s, 4H), 1.98 (s, 3H), 3.32 (s, 3H), 3.44 (d, J=10.9 Hz, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.03 (d, J=10.9 Hz, 2H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.17 (s, 1H)	$CDCl_3$
216		2－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－1, 1, 1－トリフルオロプロパン－2－オール	495 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.59 (d, J=8.3 Hz, 1H), 1.90 (s, 3H), 2.55-2.60 (m, 1H), 3.69 (d, J=5.9 Hz, 2H), 3.88 (brs, 4H), 6.99 (s, 1H), 8.00 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.07 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.36 (s, 1H)	DMSO-d_6
217		2－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－1, 1, 1－トリフルオロプロパン－2－オール	509 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.88 (s, 4H), 1.97 (s, 3H), 3.43-3.46 (m, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.03 (d, J=10.3 Hz, 2H), 7.49 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H)	$CDCl_3$

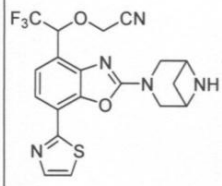
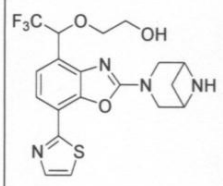
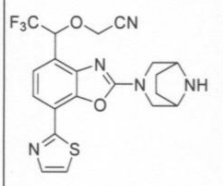
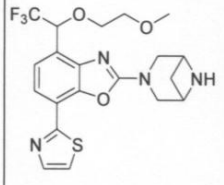
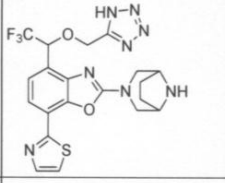
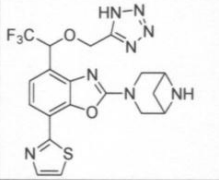
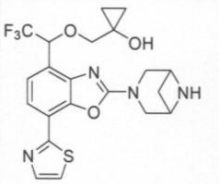
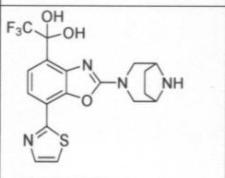
【０５７８】

【表３１】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
218		(E)－1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)エタン－1－オン O－メチルオキシムおよび(Z)－1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)エタン－1－オン O－メチルオキシム	468 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.88–1.97 (m, 2H), 2.10–2.23 (m, 2H), 2.24 (s, 3H), 3.48–3.56 (m, 2H), 3.75 (brs, 2H), 3.80 (s, 0.75H), 4.01 (s, 2.25H), 4.03–4.09 (m, 2H), 7.47–7.50 (m, 1H), 7.69 (s, 0.25H), 7.92 (s, 0.75H), 7.94–7.99 (m, 1H)	$CDCl_3$
219		(E)－1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)エタン－1－オン O－メチルオキシムおよび(Z)－1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)エタン－1－オン O－メチルオキシム	468 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.64–1.77 (m, 1H), 2.26 (s, 3H), 2.86–2.93 (m, 1H), 3.81 (s, 0.75H), 3.96 (d, J=6.0 Hz, 2H), 4.02 (s, 2.25H), 4.02–4.09 (m, 4H), 7.48–7.51 (m, 1H), 7.69–7.74 (m, 0.25H), 7.95 (s, 0.75H), 7.96–7.99 (m, 1H)	$CDCl_3$
220		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－4－(1－エトキシ－2, 2, 2－トリフルオロエチル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	439 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.24 (t, J=7.0 Hz, 3H), 1.90 (s, 4H), 3.35–3.47 (m, 2H), 3.55–3.72 (m, 4H), 4.03 (d, J=12.4 Hz, 2H), 5.37 (q, J=6.6 Hz, 1H), 7.47 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.49–7.51 (m, 1H), 7.88 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
221		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(2, 2, 2－トリフルオロ－1－(2, 2, 2－トリフルオロエトキシ)エチル)ベンゾ[d]オキサゾール	493 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89 (s, 4H), 3.43 (d, J=12.2 Hz, 2H), 3.69 (brs, 2H), 3.87–3.95 (m, 2H), 4.03 (d, J=12.2 Hz, 2H), 5.54 (q, J=6.4 Hz, 1H), 7.46 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.90 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
222		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(2, 2, 2－トリフルオロ－1－メトキシエチル)ベンゾ[d]オキサゾール	425 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89 (s, 4H), 3.44–3.49 (m, 5H), 3.69 (brs, 2H), 4.04 (d, J=12.1 Hz, 2H), 5.23–5.32 (m, 1H), 7.45 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.47 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
223		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(2, 2, 2－トリフルオロ－1－(2, 2, 2－トリフルオロエトキシ)エチル)ベンゾ[d]オキサゾール	479 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.81–2.93 (m, 1H), 3.86–3.97 (m, 4H), 3.99–4.10 (m, 4H), 5.60 (q, J=6.3 Hz, 1H), 7.47–7.49 (m, 1H), 7.50 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.93 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.99 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
224		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－4－(1－エトキシ－2, 2, 2－トリフルオロエチル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	425 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.22–1.28 (m, 3H), 1.70 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.80–2.93 (m, 1H), 3.54–3.72 (m, 2H), 3.95 (d, J=6.1 Hz, 2H), 3.99–4.08 (m, 4H), 5.34–5.52 (m, 1H), 7.48 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.52 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.91 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
225		2－(1－(2－(3. 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエトキシ)エタン－1－オール	455 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.85–2.06 (m, 4H), 3.50 (d, J=13.0 Hz, 2H), 3.57–3.64 (m, 2H), 3.66–3.74 (m, 2H), 3.75–3.79 (m, 2H), 4.05–4.12 (m, 2H), 5.49 (q, J=6.7 Hz, 1H), 7.51 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.78 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.83 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD

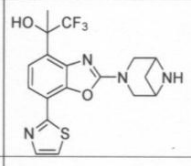
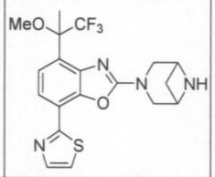
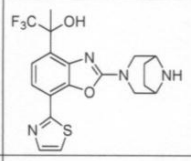
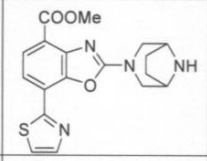
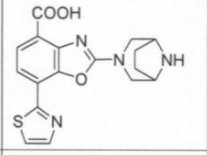
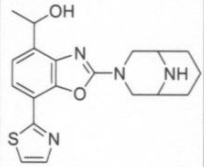
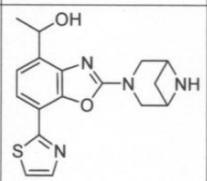
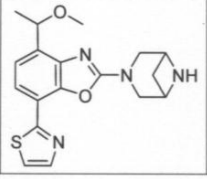
【０５７９】

【表３２】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
226		2－(1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエトキシ)アセトニトリル	436 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.78 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.94-3.04 (m, 1H), 3.95-4.01 (m, 2H), 4.02-4.15 (m, 4H), 4.23-4.27 (m, 1H), 4.40-4.44 (m, 1H), 5.63-5.66 (m, 1H), 7.45 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.51 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.94 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.99 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
227		2－(1－(2－(3. 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエトキシ)エタン－1－オール	441 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.66-1.74 (m, 1H), 3.26-3.34 (m, 1H), 3.63-3.74 (m, 2H), 3.81-3.86 (m, 2H), 4.23-4.28 (m, 2H), 4.37-4.43 (d, J=12.0 Hz, 2H), 4.53-4.57 (m, 2H), 5.31-5.36 (m, 1H), 7.44 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.50 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
228		2－(1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエトキシ)アセトニトリル	450 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.88-1.92 (m, 4H), 3.46 (d, J=12.4 Hz, 2H), 3.70 (s, 2H), 4.02-4.06 (m, 2H), 4.21-4.27 (m, 1H), 4.37-4.43 (m, 1H), 5.60 (q, J=6.4 Hz, 1H), 7.42 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.50 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.90 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
229		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(2, 2, 2－トリフルオロ－1－(2－メトキシエトキシ)エチル)ベンゾ[d]オキサゾール	455 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.62 (d, J=8.9 Hz, 1H), 2.56-2.61 (m, 1H), 3.23 (s, 3H), 3.45-3.54 (m, 2H), 3.60-3.68 (m, 2H), 3.70-3.74 (m, 2H), 3.82-3.95 (m, 4H), 5.33-5.36 (m, 1H), 7.46 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.92 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.06 (d, J=3.3 Hz, 1H)	DMSO-d_6
230		4－(1－((1H－テトラゾール－5－イル)メトキシ)－2, 2, 2－トリフルオロエチル)－2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	493 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 2.14-2.21 (m, 4H), 3.62-3.69 (m, 2H), 4.19-4.27 (m, 2H), 4.29-4.34 (m, 2H), 4.79-4.93 (m, 2H), 5.48-5.56 (m, 1H), 7.55 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.80 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.87 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6
231		4－(1－((1H－テトラゾール－5－イル)メトキシ)－2, 2, 2－トリフルオロエチル)－2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	479 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 2.02-2.07 (m, 1H), 2.90-2.98 (m, 1H), 4.13-4.25 (m, 4H), 4.49-4.53 (m, 2H), 4.77-4.85 (m, 2H), 5.68-5.74 (m, 1H), 7.51 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.91 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.03 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.09 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6
232		1－((1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエトキシ)メチル)シクロプロパン－1－オール	467 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 0.51-0.64 (m, 2H), 0.80-0.86 (m, 2H), 1.67 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.86 (dt, J=9.3, 6.3 Hz, 1H), 3.69 (d, J=11.2 Hz, 1H), 3.85-4.05 (m, 7H), 5.59 (q, J=6.7 Hz, 1H), 7.45 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.50 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.91 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
233		1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエタン－1, 1－ジオール	427 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89 (s, 4H), 3.47-3.55 (m, 2H), 3.72 (brs, 2H), 4.09-4.15 (m, 2H), 7.59 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.83-7.86 (m, 1H), 7.89-7.92 (m, 1H), 8.05 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$

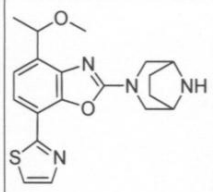
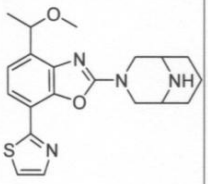
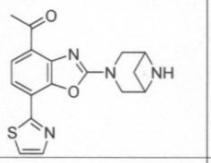
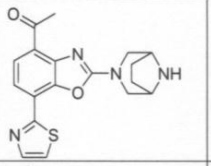
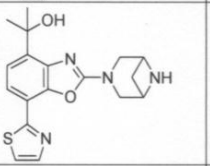
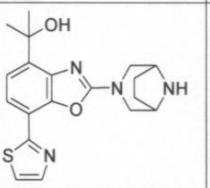
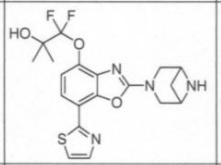
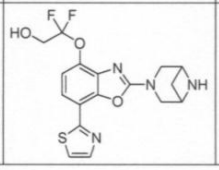
【０５８０】

【表３３】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
234		2－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－1, 1, 1－トリフルオロプロパン－2－オール	411 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.4 Hz, 1H), 1.83 (s, 3H), 2.82–2.94 (m, 1H), 3.90–3.96 (m, 2H), 3.96–4.08 (m, 4H), 7.26 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.50 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
235		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(1, 1, 1－トリフルオロ－2－メトキシプロパン－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	425 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.17 (s, 3H), 2.81–2.90 (m, 1H), 3.33 (s, 3H), 3.92 (d, J=6.1 Hz, 2H), 3.95–4.06 (m, 4H), 7.48 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.52 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.90 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
236		2－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－1, 1, 1－トリフルオロプロパン－2－オール	425 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.75–1.90 (m, 7H), 3.38 (d, J=12.1 Hz, 2H), 3.63 (s, 2H), 3.96 (d, J=12.1 Hz, 2H), 7.35 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.67 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.70 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.88 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
237		メチル 2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－カルボキシレート	371 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 2.09–2.21 (m, 4H), 3.78 (d, J=13.6 Hz, 2H), 3.97 (s, 3H), 4.26 (brs, 2H), 4.38 (d, J=13.6 Hz, 2H), 7.85 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.87–7.93 (m, 2H), 8.04 (d, J=3.2 Hz, 1H)	CD_3OD
238		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－カルボン酸	357 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.48–1.65 (m, 4H), 2.47–2.53 (m, 2H), 3.27–3.30 (m, 2H), 3.88–3.93 (m, 2H), 7.70–7.74 (m, 1H), 7.78–7.81 (m, 1H), 7.93 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.03 (d, J=3.3 Hz, 1H)	DMSO-d_6
239		1－(2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)エタン－1－オール	371 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.62–1.67 (m, 4H), 1.91–1.95 (m, 4H), 2.07–2.14 (m, 1H), 3.27 (d, J=2.9 Hz, 2H), 3.60 (dd, J=12.8, 3.9 Hz, 2H), 4.26 (d, J=12.8 Hz, 2H), 5.22 (q, J=6.7 Hz, 1H), 7.16 (dd, J=8.2, 0.61 Hz, 1H), 7.45 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.81 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
240		1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)エタン－1－オール	343 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.56 (d, J=6.5 Hz, 3H), 1.91–1.96 (m, 1H), 3.05–3.15 (m, 1H), 3.59–3.64 (m, 2H), 4.20–4.34 (m, 4H), 5.37 (q, J=6.5 Hz, 1H), 7.47 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.74 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.82 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
241		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－4－(1－メトキシエチル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	357 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.55 (d, J=6.5 Hz, 3H), 1.97–2.03 (m, 1H), 3.28–3.33 (m, 4H), 4.26–4.42 (m, 4H), 4.50–4.56 (m, 2H), 4.90 (q, J=6.5 Hz, 1H), 7.36 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.44 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.88 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$

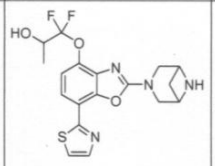
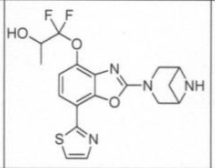
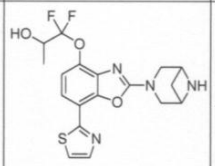
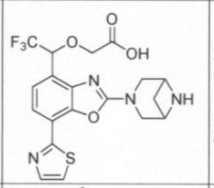
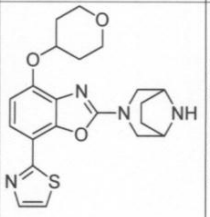
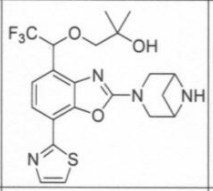
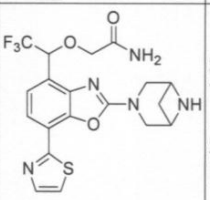
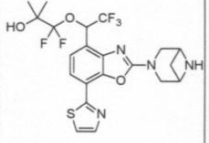
【０５８１】

【表３４】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
242		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－4－(1－メトキシエチル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	371 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.54 (d, J=6.8 Hz, 3H), 2.06-2.20 (m, 2H), 2.25-2.38 (m, 2H), 3.31 (s, 3H), 3.88 (d, J=13.6 Hz, 2H), 4.14-4.19 (m, 2H), 4.26 (d, J=13.6 Hz, 2H), 4.88 (q, J=6.8 Hz, 1H), 7.37 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.45 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
243		2－(3, 9－ジアザビシクロ[3. 3. 1]ノナン－3－イル)－4－(1－メトキシエチル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	385 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.51-1.57 (m, 3H), 1.59-1.64 (m, 1H), 2.00-2.07 (m, 4H), 2.18-2.31 (m, 1H), 3.32 (s, 3H), 3.60-3.68 (m, 2H), 3.87 (dd, J=13.5, 3.0 Hz, 2H), 4.40 (d, J=13.5 Hz, 2H), 4.92 (q, J=6.5 Hz, 1H), 7.36 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.46 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.88 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
244		1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)エタン－1－オン	341 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69-1.73 (m, 1H), 2.84-2.94 (m, 4H), 3.96 (d, J=6.1 Hz, 2H), 4.03-4.11 (m, 4H), 7.54 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.88-7.91 (m, 2H), 8.01 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
245		1－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)エタン－1－オン	355 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.93 (s, 4H), 2.90 (s, 3H), 3.54 (d, J=12.2 Hz, 2H), 3.77 (m, 2H), 4.12 (d, J=12.2 Hz, 2H), 7.53 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.85-7.88 (m, 2H), 8.01 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
246		2－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)プロパン－2－オール	371 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.65-1.74 (m, 7H), 2.84-2.95 (m, 1H), 3.93 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.98-4.04 (m, 4H), 7.19 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.45 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.82 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
247		2－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)プロパン－2－オール	371 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.67 (s, 6H), 1.89 (s, 4H), 3.43 (dd, J=12.3, 2.0 Hz, 2H), 3.61-3.73 (m, 2H), 4.02 (dd, J=12.3, 2.0 Hz, 2H), 7.16 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.44 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.79 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
248		1－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－1, 1－ジフルオロ－2－メチルプロパン－2－オール	423 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.53 (s, 6H), 1.65 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.82-2.87 (m, 1H), 3.90-4.01 (m, 7H), 7.23-7.25 (m, 1H), 7.44 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.84 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.94 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
249		2－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－2, 2－ジフルオロエタン－1－オール	395 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.86-2.92 (m, 1H), 3.79 (t, J=7.6 Hz, 2H), 3.93 (d, J=8.0 Hz, 2H), 4.00 (brs, 4H), 7.22-7.25 (m, 1H), 7.48 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.87 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$

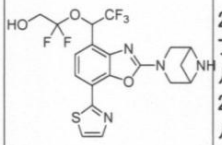
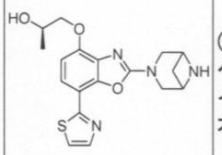
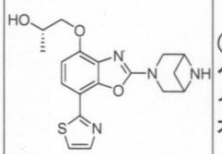
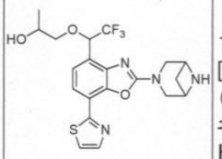
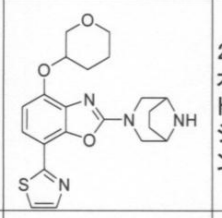
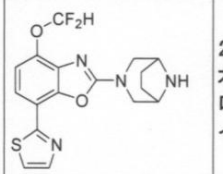
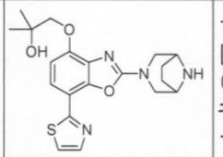
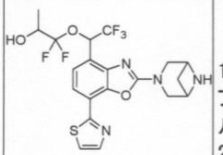
【０５８２】

【表３５】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
250		1－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－1, 1－ジフルオロプロパン－2－オール(ラセミ体)	409 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.37 (d, J=6.5 Hz, 3H), 1.67 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.85-2.90 (m, 1H), 3.92 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.95-4.04 (m, 5H), 7.22-7.24 (m, 1H), 7.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.85 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
251		1－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－1, 1－ジフルオロプロパン－2－オール(光学活性体)	409 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.37 (d, J=6.5 Hz, 3H), 1.67 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.85-2.90 (m, 1H), 3.92 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.95-4.04 (m, 5H), 7.22-7.24 (m, 1H), 7.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.85 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
252		1－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－1, 1－ジフルオロプロパン－2－オール(実施例251の鏡像異性体)	409 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.37 (d, J=6.5 Hz, 3H), 1.67 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.85-2.90 (m, 1H), 3.92 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.95-4.04 (m, 5H), 7.22-7.24 (m, 1H), 7.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.85 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
253		2-(1-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)-2,2,2-トリフルオロエトキシ)酢酸	455 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.72 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.63-2.76 (m, 1H), 3.81-4.04 m, (8H), 3.86 (d, J=16.3 Hz, 1H), 4.11 (d, J=16.3 Hz, 1H), 5.82 (q, J=6.9 Hz, 1H), 7.41 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.87 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.00 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.07 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.17 (s, 1H)	DMSO-d_6
254		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－4－((テトラヒドロ－2H－ピラン－4－イル)オキシ)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	413 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.76-1.87 (m, 2H), 1.96-2.05 (m, 4H), 2.06-2.14 (m, 2H), 3.50 (dd, J=12.8, 1.6 Hz, 2H), 3.56-3.67 (m, 2H), 3.81-3.89 (m, 2H), 3.98-4.05 (m, 2H), 4.08 (d, J= 12.8, 2.0 Hz, 2H), 4.99 (tt, J=8.3, 4.1 Hz, 1H), 6.98 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.66 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.73 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.89 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
255		1－(1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)－2, 2, 2－トリフルオロエトキシ)－2－メチルプロパン－2－オール	469 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.12 (s, 6H), 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.70-2.79 (m, 1H), 3.22-3.36 (m, 2H), 3.76-3.82 (m, 2H), 3.92-3.98 (m, 4H), 5.43 (q, J=6.4 Hz, 1H), 7.41 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.69 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.77 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.89 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
256		2-(1-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)-2,2,2-トリフルオロエトキシ)アセトアミド	454 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.87 (td, J=6.2, 9.3 Hz, 1H), 3.93 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.96-4.04 (m, 4H), 4.07 (d, J=15.3 Hz, 1H), 4.12 (d, J=15.3 Hz, 1H), 5.49 (q, J=6.6 Hz, 1H), 6.62-6.82 (m, 2H), 7.44 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.51 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.93 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.99 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
257		1-(1-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)-2,2,2-トリフルオロエトキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	505 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.37 (s, 3H), 1.44 (s, 3H), 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.80-2.91 (m, 1H), 3.50 (brs, 1H), 3.93 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.95-4.05 (m, 4H), 6.01 (q, J=6.4 Hz, 1H), 7.35 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.91 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$

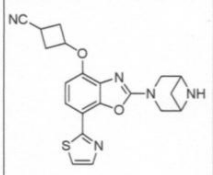
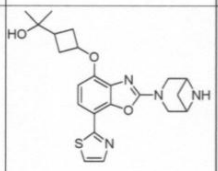
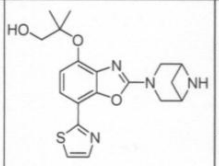
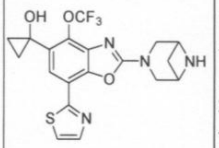
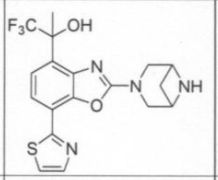
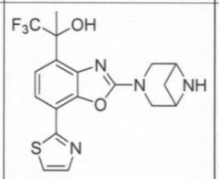
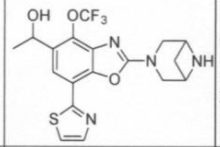
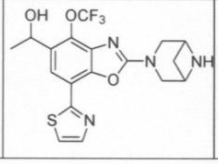
【０５８３】

【表３６】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
258		2-(1-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)-2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2,2-ジフルオロエタン-1-オール	477 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.71 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.82-2.91 (m, 1H), 3.41 (s, 1H), 3.83-3.97 (m, 4H), 3.98-4.08 (m, 4H), 6.14 (q, J=6.6 Hz, 1H), 7.44 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.52 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.90 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$, 3%CD_3OD
259		(2R)-1-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)プロパン-2-オール	373 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.28 (d, J=6.2 Hz, 3H), 1.65 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.77-2.90 (m, 1H), 3.85-4.03 (m, 6H), 4.04-4.21 (m, 1H), 4.22-4.33 (m, 2H), 6.90 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.38 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.83 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.90 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
260		(2S)-1-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)プロパン-2-オール	373 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.28 (d, J=6.4 Hz, 3H), 1.65 (brd, J=9.2 Hz, 3H), 2.77-2.91 (m, 1H), 3.85-4.03 (m, 4H), 4.04-4.16 (m, 1H), 4.21-4.34 (m, 2H), 6.90 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.33-7.41 (m, 1H), 7.83 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.89 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
261		1-(1-(2-(3, 6-ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)-2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)プロパン-2-オール	455 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.11 (d, J=6.5 Hz, 1.5H), 1.15 (d, J=6.5 Hz, 1.5H), 1.68-1.74 (m, 1H), 2.85-2.95 (m, 1H), 3.47-3.62 (m, 1H), 3.63-3.68 (m, 2H), 3.94-4.00 (m, 2H), 4.01-4.07 (m, 4H), 5.28 (q, J=6.6 Hz, 0.5H), 5.41 (q, J=6.6 Hz, 0.5H), 7.37 (d, J=8.2 Hz, 0.5H), 7.44 (d, J=8.2 Hz, 0.5H), 7.48-7.51 (m, 1H), 7.89-7.93 (m, 1H), 7.97-8.00 (m, 1H)	$CDCl_3$
262		2-(3, 8-ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン-3-イル)-4-((テトラヒドロ-2H-ピラン-3-イル)オキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	413 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.43-1.64 (m, 2H), 1.70-1.94 (m, 4H), 2.00-2.13 (m, 2H), 3.32 (dd, J=12.9, 1.8 Hz, 2H), 3.47-3.61 (m, 4H), 3.61-3.69 (m, 1H), 3.83-3.94 (m, 3H), 4.70-4.80 (m, 1H), 6.86 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.56 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.62 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.79 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
263		2-(3, 8-ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン-3-イル)-4-(ジフルオロメトキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	379 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.74-1.89 (m, 4H), 3.37 (dd, J=12.6, 2.0 Hz, 2H), 3.58-3.66 (m, 2H), 3.93 (dd, J=12.6, 2.0 Hz, 2H), 6.99 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.23 (t, J=74.4 Hz, 1H), 7.63 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.66 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.84 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
264		1-((2-(3, 8-ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-2-メチルプロパン-2-オール	401 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.26 (s, 6H), 1.75-1.92 (m, 4H), 3.39 (dd, J=12.5, 2.0 Hz, 2H), 3.61-3.69 (m, 2H), 3.86-3.95 (m, 4H), 6.83 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.55 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.64 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.79 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
265		1-(1-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)-2,2,2-トリフルオロエトキシ)-1,1-ジフルオロプロパン-2-オール	491 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.32 (d, J=6.6 Hz, 1.8H), 1.38 (d, J=6.5 Hz, 1.2H), 1.68 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.81-2.91 (m, 1H), 3.93 (d, J=6.2 Hz, 2H), 3.96-4.25 (m, 5H), 5.95 (q, J=6.7 Hz, 0.6H), 6.10 (q, J=6.5 Hz, 0.4H), 7.32 (d, J=8.3 Hz, 0.6H), 7.39 (d, J=8.3 Hz, 0.4H), 7.49 (d, J=3.2 Hz, 0.4H), 7.50 (d, J=3.2 Hz, 0.6H), 7.92 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$

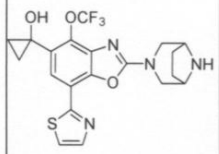
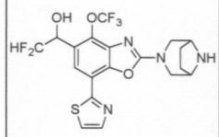
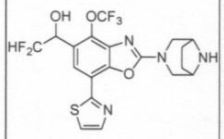
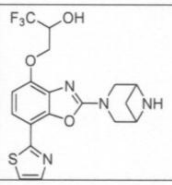
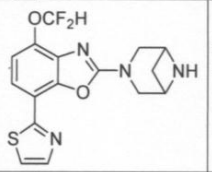
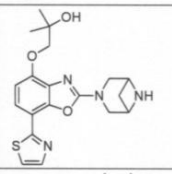
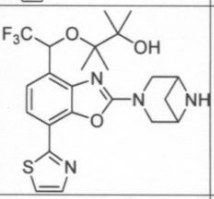
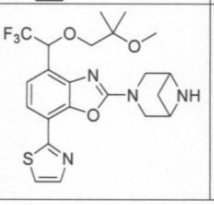
【０５８４】

【表３７】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
266		3-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)シクロブタン-1-カルボニトリル	394 (M+H)$^+$	(400 MHz) : 1.71 (d, J=9.4 Hz, 4H), 2.70-2.85 (m, 2H), 2.85-3.01 (m, 3H), 3.14-3.38 (m, 1H), 3.97-4.10 (m, 6H), 5.23-5.50 (m, 1H), 6.66 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.40 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.81 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.91 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
267		2-(3-((2-(3, 6-ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)シクロブチル)プロパン-2-オール	427 (M+H)$^+$	(400 MHz) : 1.22 (s, 6H), 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.41-2.55 (m, 5H), 2.85-2.92 (m, 1H), 3.99 (d, J=5.6 Hz, 2H), 4.02-4.12 (m, 4H), 4.93-5.01 (m, 1H), 6.64 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.37 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.79 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.89 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
268		2-((2-(3, 6-ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-2-メチルプロパン-1-オール	387 (M+H)$^+$	(400 MHz) : 1.41 (s, 6H), 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.84-2.90 (m, 1H), 3.37 (d, J=7.3 Hz, 2H), 3.92 (d, J=5.9 Hz, 2H), 3.96-4.10 (m, 4H), 6.19 (t, J=7.3 Hz, 1H), 6.98 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.45 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.81 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
269		1-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール-5-イル)シクロプロパン-1-オール	439 (M+H)$^+$	(400 MHz) : 1.07-1.13 (m, 2H), 1.22-1.29 (m, 2H), 7.99 (s, 1H), 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.75 (brs, 1H), 2.82-2.91 (m, 1H), 3.92 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.95-4.08 (m, 4H), 7.49 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
270		2-(2-(3, 6-ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)-1, 1, 1-トリフルオロプロパン-2-オール(光学活性体)	411 (M+H)$^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.4 Hz, 1H), 1.83 (s, 3H), 2.82-2.94 (m, 1H), 3.90-3.96 (m, 2H), 3.96-4.08 (m, 4H), 7.26 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.50 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
271		2-(2-(3, 6-ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)-1, 1, 1-トリフルオロプロパン-2-オール(実施例270の鏡像異性体)	411 (M+H)$^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.4 Hz, 1H), 1.83 (s, 3H), 2.82-2.94 (m, 1H), 3.90-3.96 (m, 2H), 3.96-4.08 (m, 4H), 7.26 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.50 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
272		1-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール-5-イル)エタン-1-オール(光学活性体)	427 (M+H)$^+$	(400 MHz) : 1.57 (d, J=6.4 Hz, 3H), 1.71 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.84-2.95 (m, 1H), 3.88-4.10 (m, 6H), 5.39 (q, J=6.5 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H)	$CDCl_3$
273		1-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール-5-イル)エタン-1-オール(実施例272の鏡像異性体)	427 (M+H)$^+$	(400 MHz) : 1.57 (d, J=6.4 Hz, 3H), 1.71 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.80-2.99 (m, 1H), 3.88-4.08 (m, 6H), 5.39 (q, J=6.5 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H)	$CDCl_3$

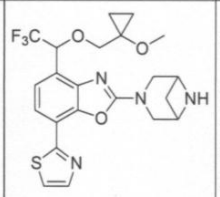
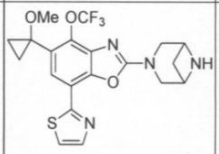
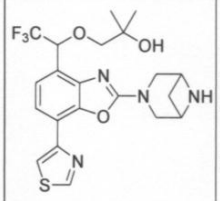
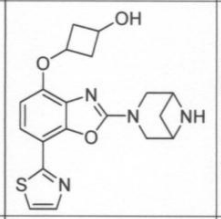
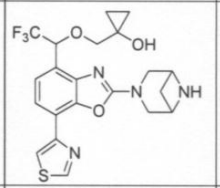
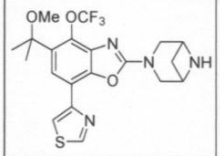
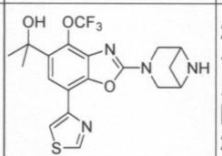
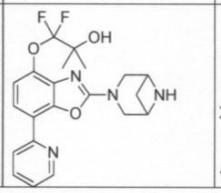
【０５８５】

【表３８】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
274		1-(2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール-5-イル)シクロプロパン-1-オール	453 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.04-1.12 (m, 2H), 1.21-1.29 (m, 2H), 1.88 (d, J=1.8 Hz, 4H), 2.70 (s, 1H), 3.44 (dd, J=2.1, 12.2 Hz, 2H), 3.68 (brs, 2H), 4.04 (dd, J=2.1, 12.2 Hz, 2H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
275		1-(2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール-5-イル)-2,2-ジフルオロエタン-1-オール(光学活性体)	477 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.90 (s, 4H), 3.38-3.58 (m, 2H), 3.71 (brs, 2H), 3.95-4.14 (m, 2H), 5.25-5.42 (m, 1H), 5.73-6.14 (m, 1H), 7.50 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H)	$CDCl_3$
276		1-(2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール-5-イル)-2,2-ジフルオロエタン-1-オール(実施例275の鏡像異性体)	477 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.90 (s, 4H), 3.48 (brd, J=12.0 Hz, 2H), 3.71 (brs, 2H), 3.97-4.11 (m, 2H), 5.34 (ddd, J=13.0, 7.0, 4.3 Hz, 1H), 5.70-6.17 (m, 1H), 7.49 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H)	$CDCl_3$
277		3-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1,1-トリフルオロプロパン-2-オール	427 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.72 (d, J=9.7 Hz, 1H), 2.70-2.83 (m, 1H), 3.86 (d, J=6.1 Hz, 2H), 3.90-4.02 (m, 4H), 4.22-4.52 (m, 3H), 6.89 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.58 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.67 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.81 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
278		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(ジフルオロメトキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	365 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.78 (d, J=9.5 Hz, 1H), 2.79-2.88 (m, 1H), 3.89 (brd, J=6.0 Hz, 2H), 3.94-4.10 (m, 4H), 7.09 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.32 (t, J=74.4 Hz, 1H), 7.72 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.77 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.93 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
279		1-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-2-メチルプロパン-2-オール	387 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.26 (s, 6H), 1.72 (d, J=9.7 Hz, 1H), 2.72-2.81 (m, 1H), 3.85 (brd, J=6.1 Hz, 2H), 3.88-4.03 (m, 6H), 6.82 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.54 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.64 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.79 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
280		3-(1-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)-2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2,3-ジメチルブタン-2-オール	497 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 0.97 (s, 3H), 1.19 (s, 3H), 1.34 (d, J=4.8 Hz, 6H), 1.71 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.83-2.88 (m, 1H), 3.93-4.06 (m, 6H), 5.31-5.36 (m, 1H), 7.34 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
281		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)-4-(2,2,2-トリフルオロ-1-(2-メトキシ-2-メチルプロポキシ)エチル)ベンゾ[d]オキサゾール	483 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.17 (s, 3H), 1.22 (s, 3H), 1.72 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.84-2.94 (m, 1H), 3.22 (s, 3H), 3.34-3.50 (m, 2H), 3.94-4.00 (m, 2H), 4.01-4.07 (m, 4H), 5.42-5.50 (q, J=6.4 Hz, 1H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.51 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.91 (d, J=8.4 Hz, 1H)	$CDCl_3$

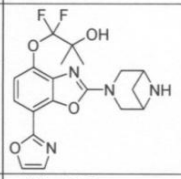
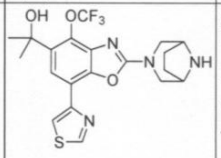
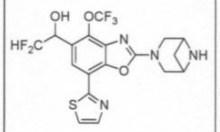
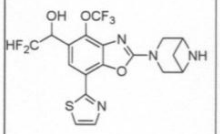
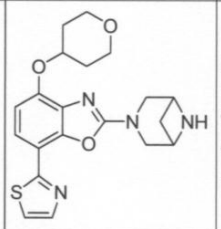
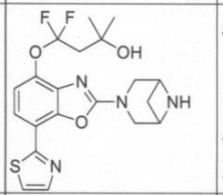
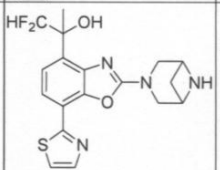
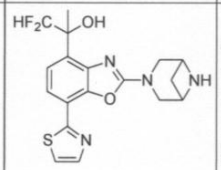
【０５８６】

【表３９】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
282		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(2, 2, 2－トリフルオロ－1－((1－メトキシシクロプロピル)メトキシ)エチル)ベンゾ[d]オキサゾール	481 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 0.48–0.60 (m, 2H), 0.77–0.87 (m, 2H), 1.71–1.75 (m, 1H), 2.02–2.07 (m, 1H), 3.34 (s, 3H), 3.58–3.71 (m, 2H), 4.26–4.43 (m, 4H), 4.50–4.56 (m, 2H), 5.51 (q, J=6.8 Hz, 1H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.56 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J=8.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
283		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-5-(1-メトキシシクロプロピル)-7-(チアゾール-2-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	453 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 0.98–1.05 (m, 2H), 1.18–1.24 (m, 2H), 1.68 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.82–2.92 (m, 1H), 3.18 (s, 3H), 3.92 (d, J=6.1 Hz, 2H), 3.96–4.09 (m, 4H), 7.50 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
284		1-(1-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-4-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)-2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-メチルプロパン-2-オール	469 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.19 (s, 3H), 1.25 (s, 3H), 1.68 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.85 (td, J=6.2, 9.1 Hz, 1H), 3.40–3.58 (m, 3H), 3.92 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.95–4.04 (m, 4H), 5.39 (q, J=6.7 Hz, 1H), 7.42 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.92 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.95 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.93 (d, J=2.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
285		3－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)シクロブタン－1－オール	385 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.62–1.68 (m, 1H), 2.46–2.56 (m, 2H), 2.65–2.76 (m, 2H), 2.81–2.89 (m, 1H), 3.90–3.95 (m, 2H), 3.97–4.09 (m, 4H), 4.67–4.75 (m, 1H), 5.14–5.22 (m, 1H), 6.66 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.38 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.80 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.90 (d, 3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
286		1-((1-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-4-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)-2,2,2-トリフルオロエトキシ)メチル)シクロプロパン-1-オール	467 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 0.52–0.63 (m, 2H), 0.78–0.87 (m, 2H), 1.67 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.80–2.91 (m, 1H), 3.70 (d, J=11.4 Hz, 1H), 3.87–4.03 (m, 7H), 5.14 (brs, 1H), 5.60 (q, J=6.7 Hz, 1H), 7.45 (d, J=7.7 Hz, 1H), 7.90–7.96 (m, 2H), 8.94 (d, J=2.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
287		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-5-(2-メトキシプロパン-2-イル)-7-(チアゾール-4-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	455 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.56 (s, 3H), 1.67 (d, J=9.2 Hz, 1H), 1.71 (s, 3H), 2.82–2.90 (m, 1H), 3.16 (s, 3H), 3.91 (d, J=5.9 Hz, 2H), 3.95–4.05 (m, 4H), 7.91 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.04 (s, 1H), 8.94 (d, J=2.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
288		2-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-4-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール-5-イル)プロパン-2-オール	441 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.55 (s, 6H), 1.92 (brs, 1H), 2.44–2.61 (m, 1H), 3.68 (d, J=5.7 Hz, 2H), 3.87 (brs, 4H), 5.35 (s, 1H), 8.22–8.26 (m, 2H), 9.28 (d, J=1.8 Hz, 1H)	$DMSO-d_6$
289		1－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(ピリジン－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－1, 1－ジフルオロ－2－メチルプロパン－2－オール	417 $(M+H)^+$	(400 MHz) :1.53 (s, 6H), 1.64 (d, J=9.4 Hz, 1H), 2.80–2.88 (m, 2H), 3.87–3.93 (m, 2H), 3.94–4.02 (m, 4H), 7.20–7.33 (m, 2H), 7.79 (dd, J=7.7, 2.0 Hz, 1H), 7.84 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.95–8.00 (m, 1H), 8.72–8.76 (m, 1H)	$CDCl_3$

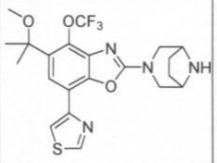
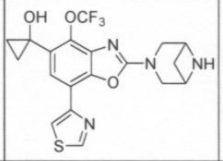
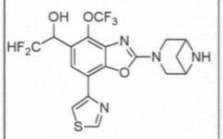
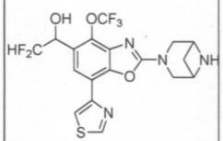
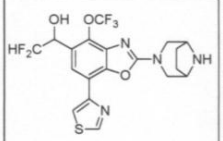
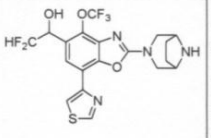
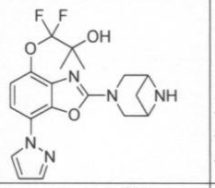
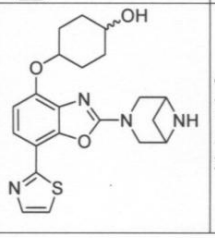
【０５８７】

【表４０】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
290		1－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(オキサゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－1, 1－ジフルオロ－2－メチルプロパン－2－オール	407 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.54 (s, 6H), 1.63-1.66 (m, 1H), 2.82-2.87 (m, 1H), 3.89-4.03 (m, 6H), 7.24-7.26 (m, 1H), 7.33 (d, J=0.73 Hz, 1H), 7.69 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.79 (d, J=0.73 Hz, 1H)	$CDCl_3$
291		2－(2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－4－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)プロパン－2－オール	455 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.73 (s, 6H), 1.86-1.91 (m, 4H), 3.43 (dd, J=12.2, 1.8 Hz, 2H), 3.69 (s, 2H), 4.00 (dd, J=12.2, 1.8 Hz, 2H), 7.85 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.93 (d, J=2.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
292		1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－2, 2－ジフルオロエタン－1－オール(光学活性体)	463 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.60 (d, J=8.8 Hz, 1H), 2.54-2.62 (m, 1H), 3.70 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.88 (brs, 4H), 5.04-5.21 (m, 1H), 5.93-6.33 (m, 1H), 6.59 (d, J=5.4 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.04 (s, 1H), 8.08 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6
293		1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－2, 2－ジフルオロエタン－1－オール(実施例292の鏡像異性体)	463 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.60 (d, J=8.8 Hz, 1H), 2.54-2.62 (m, 1H), 3.70 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.88 (brs, 4H), 5.04-5.21 (m, 1H), 5.93-6.33 (m, 1H), 6.59 (d, J=5.4 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.04 (s, 1H), 8.08 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6
294		2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－4－((テトラヒドロ－2H－ピラン－4－イル)オキシ)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール	399 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.66 (d, J=9.3 Hz, 1H), 1.72 (ddt, J=13.2, 8.8, 4.5, 4.5 Hz, 2H), 1.93-2.06 (m, 2H), 2.67-2.77 (m, 1H), 3.43-3.56 (m, 2H), 3.77 (d, J=6.1 Hz, 2H), 3.83-3.99 (m, 6H), 4.86 (tt, J=8.3, 4.0 Hz, 1H), 6.84 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.53 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.61 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.77 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
295		4－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－4, 4－ジフルオロ－2－メチルブタン－2－オール	437 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.34 (s, 6H), 1.86 (d, J=10.4 Hz, 1H), 2.38-2.49 (m, 2H), 2.85-2.95 (m, 1H), 4.00-4.11 (m, 4H), 4.16 (brd, J=6.1 Hz, 2H), 7.13-7.20 (m, 1H), 7.66 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.70 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.87 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD
296		2-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)-1,1-ジフルオロプロパン-2-オール(光学活性体)	393 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 1.73 (s, 3H), 2.81-2.94 (m, 1H), 3.93 (brd, J=5.9 Hz, 2H), 3.95-4.08 (m, 4H), 5.73-6.11 (m, 1H), 6.46 (s, 1H), 7.24-7.27 (m, 1H), 7.48 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.88 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
297		2-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)-1,1-ジフルオロプロパン-2-オール実施例296の鏡像異性体	393 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 1.73 (s, 3H), 2.80-2.96 (m, 1H), 3.93 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.95-4.08 (m, 4H), 5.70-6.13 (m, 1H), 6.46 (s, 1H), 7.24-7.27 (m, 1H), 7.48 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.88 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$

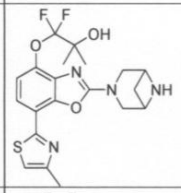
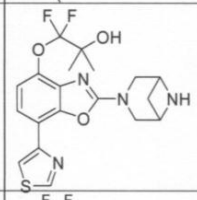
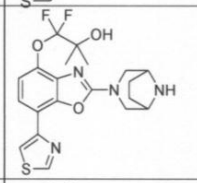
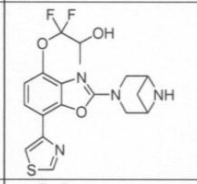
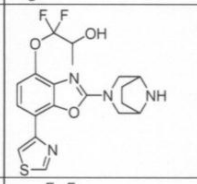
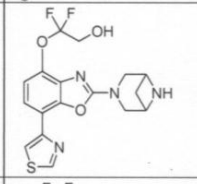
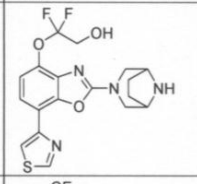
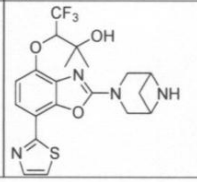
【０５８８】

【表４１】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
298		2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－5－(2－メトキシプロパン－2－イル)－7－(チアゾール－4－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	469 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.71 (s, 6H), 1.86-1.91 (m, 4H), 3.16 (s, 3H), 3.43 (dd, J=12.2, 1.9 Hz, 2H), 3.68 (s, 2H), 4.00 (dd, J=12.2, 1.9 Hz, 2H), 7.86 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.01 (s, 1H), 8.94 (d, J=2.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
299		1-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-4-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール-5-イル)シクロプロパン-1-オール	439 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.07-1.12 (m, 2H), 1.22-1.29 (m, 2H), 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.73 (s, 1H), 2.81-2.91 (m, 1H), 3.92 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.96-4.06 (m, 4H), 7.91 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.01 (s, 1H), 8.94 (d, J=2.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
300		1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－4－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－2, 2－ジフルオロエタン－1－オール(光学活性体)	463 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.58 (d, J=8.9 Hz, 1H), 2.54-2.63 (m, 1H), 3.29 (s, 1H), 3.68 (d, J=5.8 Hz, 2H), 3.89 (brs, 4H), 5.04-5.21 (m, 1H), 5.96-6.25 (m, 1H), 6.53 (d, J=4.5 Hz, 1H), 8.03 (s, 1H), 8.31 (d, J=1.8 Hz, 1H), 9.30 (d, J=1.8 Hz, 1H)	DMSO-d_6
301		1－(2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－4－イル)－4－(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール－5－イル)－2, 2－ジフルオロエタン－1－オール(実施例300の鏡像異性体)	463 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.58 (d, J=8.9 Hz, 1H), 2.54-2.63 (m, 1H), 3.29 (s, 1H), 3.68 (d, J=5.8 Hz, 2H), 3.89 (brs, 4H), 5.04-5.21 (m, 1H), 5.96-6.25 (m, 1H), 6.53 (d, J=4.5 Hz, 1H), 8.03 (s, 1H), 8.31 (d, J=1.8 Hz, 1H), 9.30 (d, J=1.8 Hz, 1H)	DMSO-d_6
302		1-(2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(チアゾール-4-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール-5-イル)-2,2-ジフルオロエタン-1-オール(光学活性体)	477 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89 (s, 4H), 2.61 (brs, 1H), 3.38-3.54 (m, 2H), 3.70 (brs, 2H), 3.93-4.09 (m, 2H), 5.25-5.42 (m, 1H), 5.74-6.15 (m, 1H), 7.87 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 8.93 (d, J=2.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
303		1-(2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(チアゾール-4-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール-5-イル)-2,2-ジフルオロエタン-1-オール(実施例302の鏡像異性体)	477 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.89 (s, 4H), 2.68 (brs, 1H), 3.38-3.55 (m, 2H), 3.70 (brs, 2H), 3.91-4.09 (m, 2H), 5.34 (ddd, J=13.1, 6.8, 4.5 Hz, 1H), 5.71-6.17 (m, 1H), 7.87 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 8.93 (d, J=2.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
304		1－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(1H－ピラゾール－1－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－1, 1－ジフルオロ－2－メチルプロパン－2－オール	406 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.52 (s, 6H), 1.66 (d, J=9.5 Hz, 1H), 2.83-2.94 (m, 1H), 3.62-3.68 (m, 2H), 3.98-4.01 (brs, 4H), 6.51 (dd, J=2.5, 1.6 Hz, 1H), 7.22 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.55 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.76 (d, J=1.6 Hz, 1H), 8.15 (d, J=2.5 Hz, 1H)	$CDCl_3$
305		4-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)シクロヘキサン-1-オール	413 $(M+H)^+$	(400 MHz) :1.08-1.74 (m, 6H), 1.75-1.93 (m, 2H), 2.00-2.17 (m, 1H), 2.56-2.65 (m, 1H), 3.46-4.03 (m, 7H), 4.50 (d, J=3.7 Hz, 0.5H), 4.57-4.61 (m, 0.5H), 4.75-4.99 (m, 1H), 6.94 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.70 (dd, J=2.9, 8.7 Hz, 1H), 7.83 (dd, J=1.1, 3.3 Hz, 1H), 7.95 (dd, J=0.7, 3.3 Hz, 1H)	DMSO-d_6

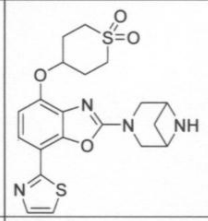
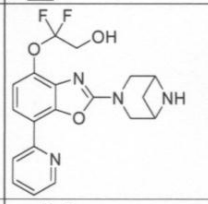
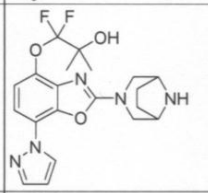
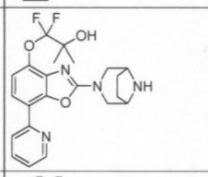
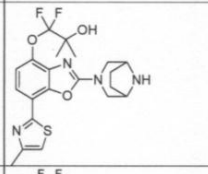
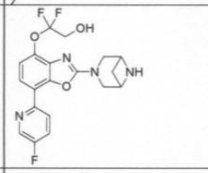
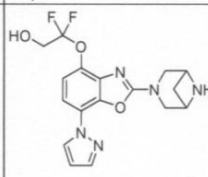
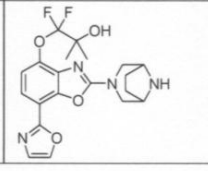
【０５８９】

【表４２】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ（ppm）	重溶媒
306		1－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(4－メチルチアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－1, 1－ジフルオロ－2－メチルプロパン－2－オール	437 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.51 (s, 6H), 1.63 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.54 (s, 3H), 2.79-2.92 (m, 1H), 3.88-4.02 (m, 6H), 6.93-7.05 (m, 1H), 7.16-7.25 (m, 1H), 7.79-7.84 (m, 1H)	$CDCl_3$
307		1－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－4－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－1, 1－ジフルオロ－2－メチルプロパン－2－オール	423 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.52 (s, 6H), 1.67 (d, J=9.5 Hz, 1H), 2.83-2.92 (m, 1H), 3.94-3.98 (m, 2H), 3.98-4.02 (m, 4H), 7.23-7.25 (m, 1H), 7.83 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.85 (d, J=8.8 Hz, 1H), 8.91 (d, J=2.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
308		1－((2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－4－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－1, 1－ジフルオロ－2－メチルプロパン－2－オール	437 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.52 (s, 6H), 1.88 (s, 4H), 3.43 (d, J=12.1 Hz, 2H), 3.70 (s, 2H), 3.95 (d, J=12.1 Hz, 2H), 7.22 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.80 (d, J=2.0 Hz, 1H), 7.84 (d, J=8.8 Hz, 1H), 8.91 (d, J=2.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
309		1－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－4－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－1, 1－ジフルオロプロパン－2－オール	409 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.36 (d, J=6.5 Hz, 3H), 1.69 (d, J=9.7 Hz, 1H), 2.86-2.96 (m, 1H), 3.95-4.06 (m, 7H), 7.23 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.84-7.89 (m, 2H), 8.92 (d, J=2.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
310		1－((2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－4－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－1, 1－ジフルオロプロパン－2－オール	423 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.32 (d, J=6.6 Hz, 3H), 1.82 (s, 4H), 3.36 (d, J=12.3 Hz, 2H), 3.58 (s, 2H), 3.90 (d, J=12.3 Hz, 2H), 4.12 (dt, J=8.8, 6.6 Hz, 1H), 7.13 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.67 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.99 (d, J=2.0 Hz, 1H), 9.01 (d, J=2.0 Hz,	CD_3OD
311		2－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－4－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－2, 2－ジフルオロエタン－1－オール	395 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.77 (d, J=9.8 Hz, 1H), 2.78-2.89 (m, 1H), 3.88-3.95 (m, 2H), 3.96-4.06 (m, 6H), 7.16 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.71 (d, J=8.7 Hz, 1H), 8.04 (d, J=2.0 Hz, 1H), 9.02 (d, J=2.0 Hz, 1H)	CD_3OD
312		2－((2－(3, 8－ジアザビシクロ[3. 2. 1]オクタン－3－イル)－7－(チアゾール－4－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－2, 2－ジフルオロエタン－1－オール	409 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.82 (s, 4H), 3.37 (d, J=12.4 Hz, 2H), 3.63 (s, 2H), 3.86-3.97 (m, 4H), 7.13 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.68 (d, J=8.7 Hz, 1H), 8.01 (d, J=1.8 Hz, 1H), 9.01 (d, J=1.8 Hz, 1H)	CD_3OD
313		3－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)－4, 4, 4－トリフルオロ－2－メチルブタン－2－オール	455 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.37 (d, J=1.2 Hz, 6H), 1.75 (d, J=9.8 Hz, 1H), 2.73-2.85 (m, 1H), 3.83-4.07 (m, 6H), 4.58- 4.75 (m, 1H), 7.13 - 7.21 (m, 1H), 7.67 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.72 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.87 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CD_3OD

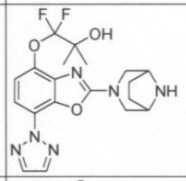
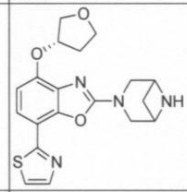
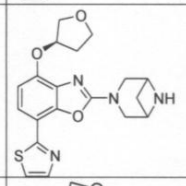
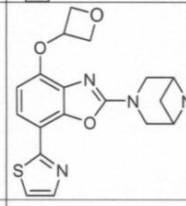
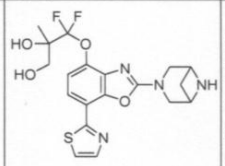
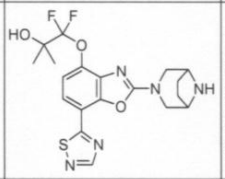
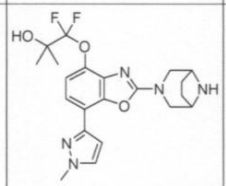
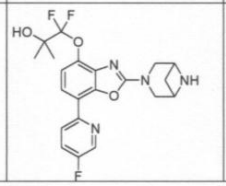
【０５９０】

【表４３】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
314		4－((2－(3, 6－ジアザビシクロ[3. 1. 1]ヘプタン－3－イル)－7－(チアゾール－2－イル)ベンゾ[d]オキサゾール－4－イル)オキシ)テトラヒドロ－2H－チオピラン1, 1－ジオキシド	447 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.70 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.33–2.46 (m, 2H), 2.48–2.59 (m, 2H), 2.81–3.03 (m, 3H), 3.59 (td, J=13.3, 3.5 Hz, 2H), 3.92–4.06 (m, 6H), 5.29 (tt, J=4.4, 2.1 Hz, 1H), 6.90 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.42 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.82 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.92 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
315		2-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(ピリジン-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-2,2-ジフルオロエタン-1-オール	389 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.65 (d, J=9.5 Hz, 1H), 2.78–2.89 (m, 1H), 3.76 (t, J=7.5 Hz, 2H), 3.91 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.95 (s, 4H), 6.22 (brs, 1H), 7.20–7.25 (m, 1H), 7.25–7.30 (m, 1H), 7.77–7.84 (m, 2H), 7.95 (d, J=7.9 Hz, 1H), 8.74 (dd, J=4.9, 0.9 Hz, 1H)	$CDCl_3$
316		1-((2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(1H-ピラゾール-1-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	420 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.53 (s, 6H), 1.87 (s, 4H), 3.41 (dd, J=12.1, 2.0 Hz, 2H), 3.67 (brs, 2H), 3.91 (brd, J=12.1 Hz, 2H), 6.50–6.56 (m, 1H), 7.21 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.51–7.58 (m, 1H), 7.77 (d, J=1.5 Hz, 1H), 8.13 (d, J=2.5 Hz, 1H)	$CDCl_3$
317		1-((2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(ピリジン-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	431 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.53 (s, 6H), 1.83–1.94 (m, 4H), 3.41 (dd, J=12.1, 2.0 Hz, 2H), 3.67 (brs, 2H), 3.93 (dd, J=12.0, 2.1 Hz, 2H), 7.24–7.29 (m, 2H), 7.77–7.85 (m, 2H), 7.94 (dt, J=7.95, 0.98 Hz, 1H), 8.71–8.78 (m, 1H)	$CDCl_3$
318		1-((2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(4-メチルチアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	451 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.52 (s, 6H), 1.88 (s, 4H), 2.56 (s, 3H), 3.44 (brd, J=12.1 Hz, 2H), 3.69 (brs, 2H), 3.98 (brd, J=10.8 Hz, 2H), 7.00 (s, 1H), 7.22 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.80 (d, J=8.7 Hz, 1H)	$CDCl_3$
319		2-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(5-フルオロピリジン-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-2,2-ジフルオロエタン-1-オール	407 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.67 (d, J=8.8 Hz, 1H), 2.84–2.91 (m, 1H), 3.79 (t, J=7.2 Hz, 2H), 3.96 (s, 6H), 7.20–7.28 (m, 1H), 7.49–7.55 (m, 1H), 7.77 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.96 (dd, J=3.6, 8.4 Hz, 1H), 8.59 (brs, 1H)	$CDCl_3$
320		2-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(1H-ピラゾール-1-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-2,2-ジフルオロエタン-1-オール	378 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.66 (d, J=9.5 Hz, 1H), 2.84–2.92 (m, 1H), 3.49 (s, 1H), 3.78 (t, J=7.5 Hz, 2H), 3.92 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.96 (s, 4H), 6.54 (t, J=2.1 Hz, 1H), 7.22 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.59 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.78 (d, J=1.5 Hz, 1H), 8.16 (d, J=2.4 Hz, 1H)	$CDCl_3$
321		1-((2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(オキサゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	421 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.52 (s, 6H), 1.83–1.92 (m, 4H), 3.42 (dd, J=12.2, 1.9 Hz, 2H), 3.67 (brs, 2H), 4.00 (dd, J=12.2, 2.1 Hz, 2H), 7.20–7.25 (m, 1H), 7.32 (d, J=0.7 Hz, 1H), 7.67 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.78 (d, J=0.7 Hz, 1H)	$CDCl_3$

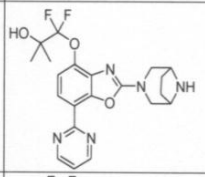
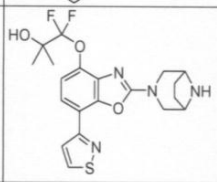
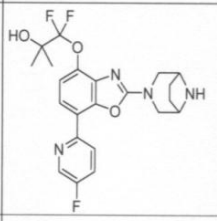
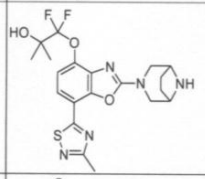
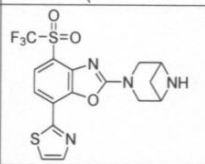
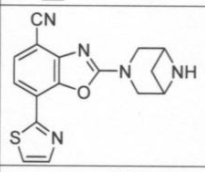
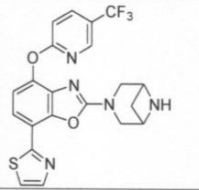
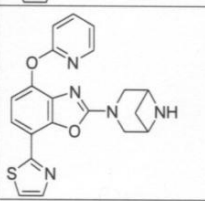
【０５９１】

【表４４】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
322		1-((2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	421 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.53 (s, 6H), 1.82-1.91 (m, 4H), 3.41 (dd, J=12.2, 2.0 Hz, 2H), 3.66 (brs, 2H), 3.97 (dd, J=12.2, 2.3 Hz, 2H), 7.21-7.26 (m, 1H), 7.62 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.89 (s, 2H)	$CDCl_3$
323		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(((S)-テトラヒドロフラン-3-イル)オキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	385 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.17 Hz, 1H), 2.25-2.35 (m, 2H), 2.81-2.92 (m, 1H), 3.90-4.13 (m, 10H), 5.44-5.53 (m, 1H), 6.81 (d, J=8.80 Hz, 1H), 7.40 (d, J=3.30 Hz, 1H), 7.82 (d, J=8.68 Hz, 1H), 7.91 (d, J=3.18 Hz, 1H)	$CDCl_3$
324		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(((R)-テトラヒドロフラン-3-イル)オキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	385 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.24-2.34 (m, 2H), 2.81-2.91 (m, 1H), 3.88-4.15 (m, 10H), 5.45-5.53 (m, 1H), 6.81 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.40 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.82 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.91 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
325		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(オキセタン-3-イルオキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	371 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.17 Hz, 1H), 2.83-2.92 (m, 1H), 3.91-4.09 (m, 6H), 4.89-4.96 (m, 2H), 5.01-5.08 (m, 2H), 5.58 (quin, J=5.7 Hz, 1H), 6.55 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.41 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.80 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.92 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
326		3-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-3,3-ジフルオロ-2-メチルプロパン-1,2-ジオール	439 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.38 (s, 3H), 1.61 (d, J=8.8 Hz, 1H), 2.54-2.61 (m, 1H), 3.57-3.73 (m, 4H), 3.79-3.94 (m, 4H), 4.97 (t, J=6.6 Hz, 1H), 5.51 (s, 1H), 7.22 d, J=8.7 Hz, 1H), 7.78 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.04 (d, J=3.3 Hz, 1H)	DMSO-d_6
327		1-((2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(1,2,4-チアジアゾール-5-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	438 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.53 (s, 6H), 1.90 (brs, 4H), 3.43-3.55 (m, 2H), 3.71 (brs, 2H), 3.98 (dd, J=12.1, 2.1 Hz, 2H), 7.29-7.36 (m, 1H), 7.88 (d, J=8.8 Hz, 1H), 8.77 (s, 1H)	$CDCl_3$
328		1-((2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	434 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.52 (s, 6H), 1.82-1.92 (m, 4H), 3.39 (brd, J=10.8 Hz, 2H), 3.65 (brs, 2H), 3.89-3.97 (m, 2H), 4.00 (s, 3H), 4.12 (brs, 1H), 6.73 (d, J=2.2 Hz, 1H), 7.16 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.44 (d, J=2.2 Hz, 1H), 7.57 (d, J=8.6 Hz, 1H)	$CDCl_3$
329		1-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(5-フルオロピリジン-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	435 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.52 (s, 6H), 1.64 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.80-2.88 (m, 1H), 3.85-3.97 (m, 6H), 7.30 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.50 (td, J=8.3, 2.9 Hz, 1H), 7.77 (t, J=4.4 Hz, 1H), 7.95 (q, J=4.4 Hz, 1H), 8.58 (d, J=2.9 Hz, 1H)	$CDCl_3$

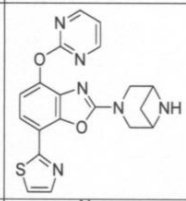
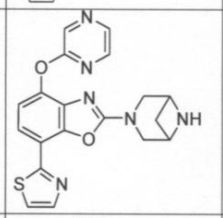
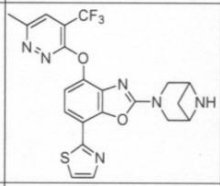
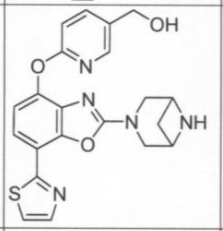
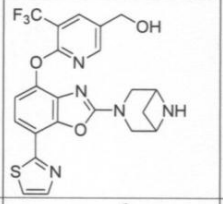
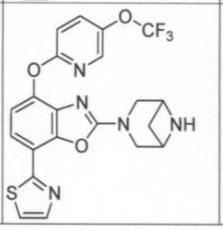
【０５９２】

【表４５】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
330		1-((2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(ピリミジン-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	432 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.53 (s, 6H), 1.81-1.94 (m, 4H), 3.40 (dd, J=12.1, 1.7 Hz, 2H), 3.66 (brs, 2H), 3.99 (dd, J=12.0, 2.0 Hz, 2H), 4.18 (brs, 1H), 7.21-7.25 (m, 2H), 7.97 (d, J=8.68 Hz, 1H), 8.87 (d, J=4.89 Hz, 2H)	$CDCl_3$
331		1-((2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(イソチアゾール-3-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	437 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.53 (s, 6H), 1.88 (s, 4H), 3.42 (dd, J=12.0, 1.7 Hz, 2H), 3.68 (brs, 2H), 3.95 (dd, J=12.0, 2.1 Hz, 2H), 7.24 (d, J=8.6 Hz, 2H), 7.77 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.82 (d, J=4.8 Hz, 1H), 8.79 (d, J=4.7 Hz, 1H)	$CDCl_3$
332		1-((2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(5-フルオロピリジン-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	449 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.53 (s, 6H), 1.88 (d, J=1.83 Hz, 4H), 3.41 (dd, J=12.0, 2.2 Hz, 2H), 3.67 (brs, 2H), 3.92 (dd, J=11.9, 2.1 Hz, 2H), 4.04 (brs, 1H), 7.23-7.30 (m, 1H), 7.53 (ddd, J=8.8, 7.9, 2.9 Hz, 1H), , 7.76 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.95 (dd, J=8.7, 4.3 Hz, 1H), 8.60 (d, J=2.8 Hz, 1H)	$CDCl_3$
333		1-((2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(3-メチル-1,2,4-チアジアゾール-5-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	452 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.54 (s, 6H), 1.89 (s, 4H), 2.77 (s, 3H), 3.46 (dd, J=12.3, 1.8 Hz, 2H), 3.55 (brs, 1H), 3.70 (brs, 2H), 3.98 (dd, J=12.1, 2.1 Hz, 2H), 7.23-7.28 (m, 1H), 7.84 (d, J=8.80 Hz, 1H)	$CDCl_3$
334		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)-4-((トリフルオロメチル)スルホニル)ベンゾ[d]オキサゾール	431 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.4 Hz, 1H), 2.87-2.93 (m, 1H), 3.92-3.97 (m, 2H), 4.04-4.14 (m, 4H), 7.64 (d, J= 3.3 Hz, 1H), 7.87 (d, J=8.7 Hz, 1H), 8.03 (d, J=8.7 Hz, 1H), 8.08 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
335		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-カルボニトリル	324 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.86-2.93 (m, 1H), 3.92-3.97 (m, 2H), 4.00-4.10 (m, 4H), 7.52 (d, J= 8.4 Hz, 1H), 7.57 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.03 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
336		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)-4-((5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)オキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	460 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.65 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.78-2.91 (m, 1H), 3.86-4.06 (m, 6H), 7.13 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.20 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.47 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.89-8.01 (m, 3H), 8.43-8.45 (m, 1H)	$CDCl_3$
337		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(ピリジン-2-イルオキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	392 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.65 (d, J=9.4 Hz, 1H), 2.79-2.88 (m, 1H), 3.89 (d, J=6.1 Hz, 2H), 3.92-4.06 (m, 4H), 7.00-7.05 (m, 1H), 7.07-7.05 (m, 2H), 7.45 (d, J=3.2 Hz, 1H),7.71-7.76 (m, 1H), 7.90 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.17-8.24 (m, 1H)	$CDCl_3$

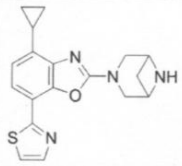
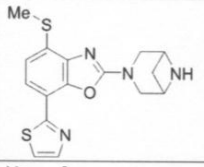
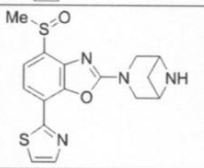
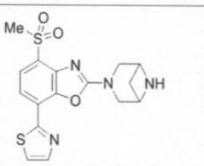
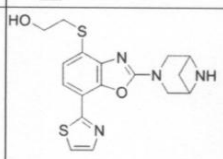
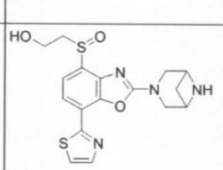
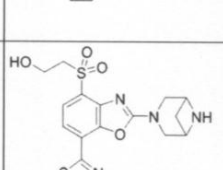
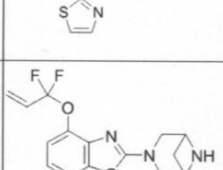
【０５９３】

【表４６】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
338		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(ピリミジン-2-イルオキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	393 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.64 (d, J=9.2 Hz, 2H), 2.77-2.89 (m, 1H), 3.84-4.05 (m, 6H), 7.07 (t, J=4.8 Hz, 1H), 7.17 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.46 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.93 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.59 (d, J=4.8 Hz, 2H)	$CDCl_3$
339		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(ピラジン-2-イルオキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	393 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.64 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.77-2.89 (m, 1H), 3.83-4.05 (m, 6H), 7.13 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.46 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.92 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.11 (dd, J=2.6, 1.4 Hz, 1H), 8.29 (d, J=2.7 Hz, 1H), 8.58 (d, J=1.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
340		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-((6-メチル-4-(トリフルオロメチル)ピリダジン-3-イル)オキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	475 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.63 (d, J=9.3 Hz, 2H), 2.75 (s, 3H), 2.77-2.86 (m, 1H), 3.82-4.00 (m, 6H), 7.18 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.47 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.92 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
341		(6-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)ピリジン-3-イル)メタノール	422 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.65 (d, J=9.2 Hz, 2H), 2.77-2.90 (m, 1H), 3.89 (d, J=6.1 Hz, 2H), 3.92-4.07 (m, 4H), 4.69 (s, 2H), 7.08 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.12 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.45 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.79 (dd, J=8.4, 2.5 Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.14-8.20 (m, 1H)	$CDCl_3$
342		(6-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル)メタノール	490 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.64 (d, J=9.2 Hz, 2H), 2.78-2.88 (m, 1H), 3.83-4.03 (m, 6H), 4.74 (s, 2H), 7.09 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.46 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.91 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.08 (d, J=1.8 Hz, 1H), 8.23-8.26 (m, 1H)	$CDCl_3$
343		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)-4-((5-(トリフルオロメトキシ)ピリジン-2-イル)オキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	476 $(M+H)^+$	(400 MHz) : 1.65 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.78-2.89 (m, 1H), 3.90 (d, J=6.1 Hz, 2H), 3.92-4.06 (m, 4H), 7.11 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.15 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.46 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.59-7.66 (m, 1H), 7.91 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.10 (d, J=2.9 Hz, 1H)	$CDCl_3$

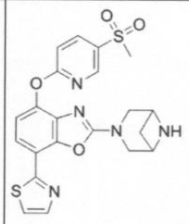
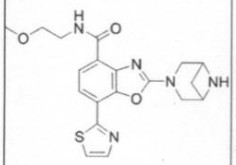
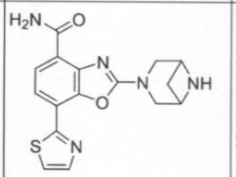
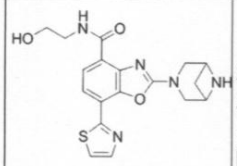
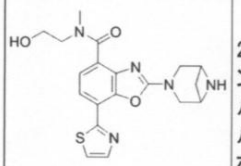
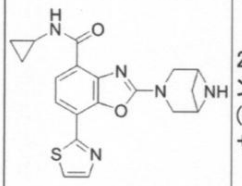
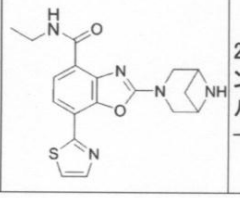
【０５９４】

【表４７】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ（ppm）	重溶媒
344		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-シクロプロピル-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	339 (M+H)+	(400 MHz) : 1.00-1.09 (m, 4H), 1.81 (d, J=9.5 Hz, 1H), 2.28-2.36 (m, 1H), 2.73-2.80 (m, 1H), 3.98-4.06 (m, 4H), 4.08-4.13 (m, 2H), 6.91 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.70 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.90 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.00 (d, J=3.3 Hz, 1H)	DMSO-d_6
345		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(メチルチオ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	345 (M+H)+	(400 MHz) : 1.67 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.64 (s, 3H), 2.81-2.88 (m, 1H), 3.89-3.94 (m, 2H), 3.97-4.08 (m, 4H), 7.14 (d, J= 8.4 Hz, 1H), 7.43 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.84 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.93 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
346		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(メチルスルフィニル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	361 (M+H)+	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.85-2.92 (m, 1H), 2.99 (s, 3H), 3.91-4.06 (m, 6H), 7.52 (d, J= 3.2 Hz, 1H), 7.77 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.00 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.03 (d, J=8.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
347		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(メチルスルホニル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	377 (M+H)+	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.4 Hz, 1H), 2.86-2.93 (m, 1H), 3.42 (s, 3H), 3.92-3.97 (m, 2H), 4.01-4.12 (m, 4H), 7.58 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.87 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.96 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.03 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
348		2-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)チオ)エタン-1-オール	375 (M+H)+	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.83-2.90 (m, 1H), 3.14-3.18 (m, 2H), 3.70-3.74 (m, 2H), 3.91-3.95 (m, 2H), 3.97-4.07 (m, 4H), 7.42 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.81 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
349		2-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)スルフィニル)エタン-1-オール	391 (M+H)+	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.85-2.92 (m, 1H), 3.42-3.46 (m, 2H), 3.91-4.03 (m, 7H), 4.07-4.15 (m, 1H), 7.54 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.82 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.09 (d, J=8.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
350		2-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)スルホニル)エタン-1-オール	407 (M+H)+	(400 MHz) : 1.63 (d, J=9.1 Hz, 1H), 2.57-2.64 (m, 1H), 3.68-3.81 (m, 6H), 3.84-4.05 (m, 4H), 4.85 (t, J=5.4 Hz, 1H), 7.70 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.91 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.10 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.14 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6
351		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-((1,1-ジフルオロアリル)オキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	391 (M+H)+	(400 MHz) : 1.67 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.82-2.89 (m, 1H), 3.90-3.94 (m, 2H), 3.97-4.07 (m, 4H), 5.60-5.64 (m, 1H), 5.96-6.03 (m, 1H), 6.13-6.25 (m, 1H), 7.23-7.27 (m, 1H), 7.45 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.83 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$

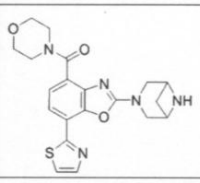
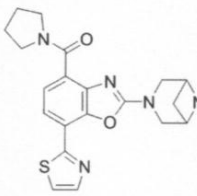
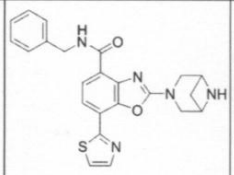
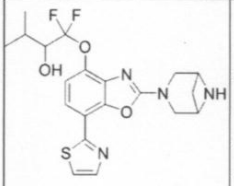
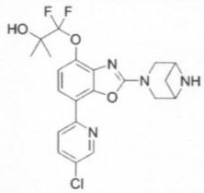
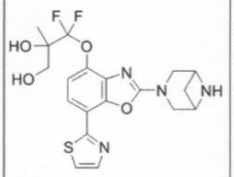
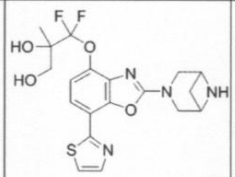
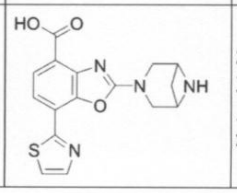
【０５９５】

【表４８】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
352		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-((5-(メチルスルホニル)ピリジン-2-イル)オキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	470 (M+H)+	(400 MHz) : 1.65 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.80-2.88 (m, 1H), 3.10 (s, 3H), 3.86-4.03 (m, 6H), 5.15-5.17 (m, 1H), 7.13 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.24 (dd, J=8.7, 0.5 Hz, 1H), 7.48 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.94 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.22 (dd, J=8.8, 2.6 Hz, 1H), 8.70 (d, J=2.0 Hz, 1H)	$CDCl_3$
353		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-N-(2-メトキシエチル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-カルボキサミド	400 (M+H)+	(400 MHz) : 1.71 (d, J=9.4 Hz, 1H), 2.85-2.98 (m, 1H), 3.44 (s, 3H), 3.61-3.69 (m, 2H), 3.76 (q, J=5.3 Hz, 2H), 3.96 (brd, J=6.0 Hz, 2H), 3.99-4.17 (m, 4H), 7.52 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.93 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.11 (d, J=8.3 Hz, 1H), 9.40 (t, J=5.1 Hz, 1H)	$CDCl_3$
354		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-カルボキサミド	342 (M+H)+	(400 MHz) : 1.71 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.85-2.99 (m, 1H), 3.91-4.16 (m, 6H), 5.81 (brs, 1H), 7.54 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.95 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.02 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.11 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.90 (brs, 1H)	$CDCl_3$
355		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-N-(2-ヒドロキシエチル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-カルボキサミド	386 (M+H)+	(400 MHz) : 1.71 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.86-2.96 (m, 1H), 3.15 (brs, 1H), 3.70-3.78 (m, 2H), 3.87-3.92 (m, 2H), 3.96 (brd, J=6.0 Hz, 2H), 3.99-4.14 (m, 4H), 7.53 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.10 (d, J=8.4 Hz, 1H), 9.39 (brt, J=5.4 Hz, 1H)	$CDCl_3$
356		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-N-(2-ヒドロキシエチル)-N-メチル-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-カルボキサミド	400 (M+H)+	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.82-2.93 (m, 1H), 3.06 (brs, 1.35H), 3.20 (s, 1.65H), 3.50 (brs, 1H), 3.81 (brs, 2H), 3.91-4.07 (m, 7H), 4.72 (brs, 0.45H), 5.84 (brs, 0.55H), 7.48 (brd, J=8.3Hz, 1H), 7.52 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.95 (brd, J=7.2 Hz, 1H), 8.00 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
357		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-N-シクロプロピル-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-カルボキサミド	382 (M+H)+	(400 MHz) : 0.63-0.72 (m, 2H), 0.87-0.98 (m, 2H), 1.71 (d, J=9.4 Hz, 1H), 2.86-2.96 (m, 1H), 3.04 (tq, J=7.3, 3.7 Hz, 1H), 3.92-4.14 (m, 6H), 7.52 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.93 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.13 (d, J=8.4 Hz, 1H), 9.14 (brs, 1H)	$CDCl_3$
358		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-N-エチル-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-カルボキサミド	370 (M+H)+	(400 MHz) : 1.32 (t, J=7.3 Hz, 3H), 1.72 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.88-3.00 (m, 1H), 3.59 (qd, J=7.3, 5.5 Hz, 2H), 3.97-4.13 (m, 6H), 7.52 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.92 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.00 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.11 (d, J=8.3 Hz, 1H), 9.01 (brs, 1H)	$CDCl_3$

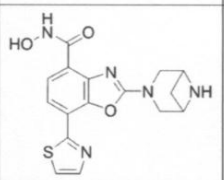
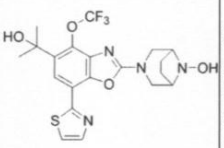
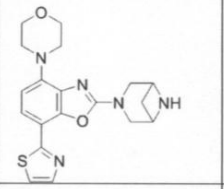
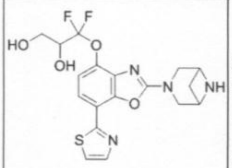
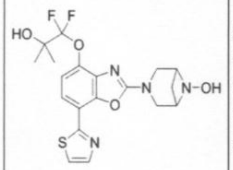
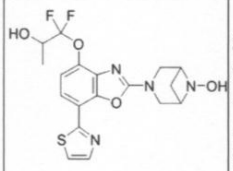
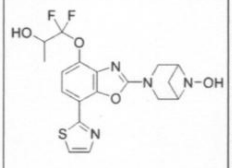
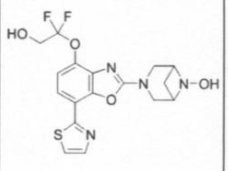
【０５９６】

【表４９】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
359		(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)(モルホリノ)メタノン	412 (M+H)+	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.83-2.95 (m, 1H), 3.46 (brs, 2H), 3.70-4.13 (m, 12H), 7.43 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.46-7.51 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.91 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.99 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
360		(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)(ピロリジン-1-イル)メタノン	396 (M+H)+	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.2 Hz, 1H), 1.85-2.05 (m, 4H), 2.81-2.93 (m, 1H), 3.51 (t, J=6.7 Hz, 2H), 3.75 (t, J=7.0 Hz, 2H), 3.88-4.09 (m, 6H), 7.44 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.50 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.99 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
361		N-ベンジル-2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-カルボキサミド	432 (M+H)+	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.82-2.94 (m, 1H), 3.85-4.11 (m, 6H), 4.79 (d, J=5.5 Hz, 2H), 7.29-7.41 (m, 3H), 7.43-7.48 (m, 2H), 7.52 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.95 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.16 (d, J=8.4 Hz, 1H), 9.49 (brs, 1H)	$CDCl_3$
362		1-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-3-メチルブタン-2-オール	437 (M+H)+	(400 MHz) : 1.06 (d, J=6.9 Hz, 3H), 1.09 (d, J=6.7 Hz, 3H), 1.70 (d, J=9.6 Hz, 1H), 2.10-2.20 (m, 1H), 2.91 (dd, J=15.0, 6.2 Hz, 1H), 3.66 (dd, J=17.2, 3.6 Hz, 1H), 3.95-4.06 (m, 6H), 7.23 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.46 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.83 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.95 (q, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
363		1-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(5-クロロピリジン-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	451 (M+H)+	(400 MHz) : 1.48 (s, 6H), 1.70-1.80 (m, 1H), 3.05-3.15 (m, 1H), 4.08 (d, J=10.8 Hz, 2H), 4.20-4.50 (m, 4H), 7.20-7.30 (m, 1H), 7.70-7.80 (m, 2H), 7.80-7.85 (m, 1H), 8.62-8.70 (m, 1H)	$CDCl_3$
364		3-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-3,3-ジフルオロ-2-メチルプロパン-1,2-ジオール(光学活性体)	439 (M+H)+	(400 MHz) : 1.38 (s, 3H), 1.61 (d, J=8.9 Hz, 1H), 2.55-2.62 (m, 1H), 3.57-3.74 (m, 4H), 3.80-3.95 (m, 4H), 4.97 (t, J=6.5 Hz, 1H), 5.51 (s, 1H), 7.22 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.78 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.04 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6
365		3-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-3,3-ジフルオロ-2-メチルプロパン-1,2-ジオール(実施例364の鏡像異性体)	439 (M+H)+	(400 MHz) : 1.38 (s, 3H), 1.61 (d, J=8.8 Hz, 1H), 2.55-2.62 (m, 1H), 3.57-3.74 (m, 4H), 3.80-3.95 (m, 4H), 4.98 (brs, 1H), 5.51 (brs, 1H), 7.22 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.78 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.04 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6
366		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-カルボン酸	343 (M+H)+	(400 MHz) : 1.61 (d, J=8.9 Hz, 1H), 2.56-2.64 (m, 1H), 3.17 (s, 1H), 3.72 (brd, J=6.1 Hz, 2H), 3.82-4.04 (m, 4H), 7.75-7.84 (m, 2H), 8.02 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.09 (d, J=3.1 Hz, 1H)	DMSO-d_6

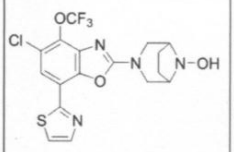
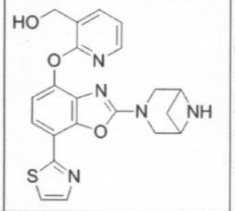
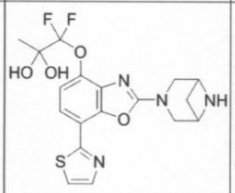
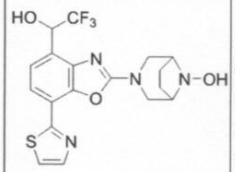
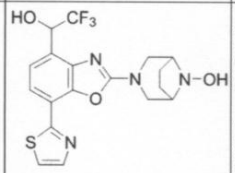
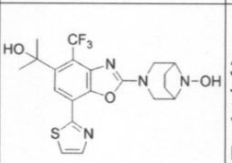
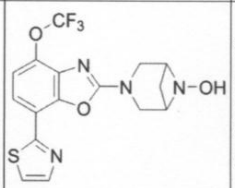
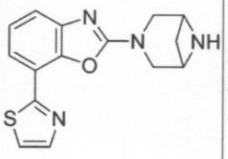
【０５９７】

【表５０】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
367		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-N-ヒドロキシ-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-カルボキサミド	358 (M+H)+	(400 MHz) : 1.61 (brd, J=8.0 Hz, 1H), 2.56-2.65 (m, 1H), 3.65-3.76 (m, 2H), 3.80-4.07 (m, 5H), 4.14-4.52 (m, 1H), 7.75-7.89 (m, 2H), 7.95-8.03 (m, 1H), 8.03-8.16 (m, 1H)	DMSO-d_6
368		3-(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-7-(チアゾール-2-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)-3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-オール	471 (M+H)+	(400 MHz) : 1.73 (s, 6H), 1.75-1.83 (m, 2H), 2.18-2.27 (m, 2H), 3.50 (s, 1H), 3.54 (brd, J=11.9 Hz, 2H), 3.66-3.75 (m, 2H), 4.03-4.15 (m, 2H), 5.24 (brs, 1H), 7.48 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.17 (s, 1H)	$CDCl_3$
369		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-モルホリノ-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	384 (M+H)+	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.1 Hz, 1H), 2.78-2.92 (m, 1H), 3.52-3.64 (m, 4H), 3.87-4.12 (m, 10H), 6.73 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.37 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.82 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.90 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
370		3-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-3,3-ジフルオロプロパン-1,2-ジオール	425 (M+H)+	(400 MHz) : 1.61 (d, J=8.8 Hz, 1H), 1.96 (brs, 1H), 2.55-2.62 (m, 1H), 3.54-3.62 (m, 1H), 3.68-3.73 (m, 2H), 3.81-4.05 (m, 6H), 4.94 (t, J=6.2 Hz, 1H), 6.07 (d, J=6.4 Hz, 1H), 7.22 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.78 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.04 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6
371		3-(4-(1,1-ジフルオロ-2-ヒドロキシ-2-メチルプロポキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)-3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-6-オール	439 (M+H)+	(400 MHz) : 1.52 (s, 6H), 1.73 (d, J=9.9 Hz, 1H), 2.19-2.26 (m, 1H), 3.76-3.82 (m, 2H), 3.92-3.96 (m, 2H), 4.21-4.27 (m, 2H), 7.26-7.30 (m, 1H), 7.45 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.82 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.94 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
372		3-(4-(1,1-ジフルオロ-2-ヒドロキシプロポキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)-3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-6-オール(光学活性体)	425 (M+H)+	(400 MHz) : 1.39 (d, J=6.5 Hz, 3H), 1.76 (d, J=10.0 Hz, 1H), 2.22-2.29 (m, 1H), 3.76-3.84 (m, 2H), 3.95-3.99 (m, 2H), 4.01-4.10 (m, 1H), 4.21-4.29 (m, 2H), 5.57 (brs, 1H), 7.22-7.27 (m, 1H), 7.47 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.83 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
373		3-(4-(1,1-ジフルオロ-2-ヒドロキシプロポキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)-3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-6-オール(実施例372の鏡像異性体)	425 (M+H)+	(400 MHz) : 1.39 (d, J=6.5 Hz, 3H), 1.76 (d, J=9.9 Hz, 1H), 2.22-2.29 (m, 1H), 3.76-3.84 (m, 2H), 3.95-3.99 (m, 2H), 4.01-4.10 (m, 1H), 4.21-4.29 (m, 2H), 5.63 (brs, 1H), 7.22-7.27 (m, 1H), 7.47 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.83 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
374		3-(4-(1,1-ジフルオロ-2-ヒドロキシエトキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)-3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-6-オール	411 (M+H)+	(400 MHz) : 1.76 (d, J=9.7 Hz, 1H), 2.07-2.14 (m, 1H), 3.70-3.78 (m, 2H), 3.82-3.86 (m, 2H), 3.89-4.04 (m, 4H), 5.96 (t, J=6.8 Hz, 1H), 7.24 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.79 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.04 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6

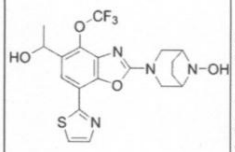
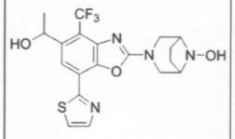
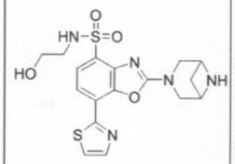
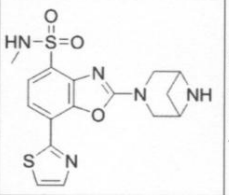
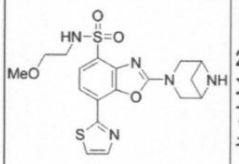
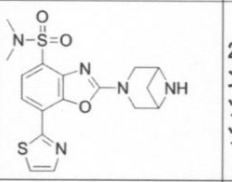
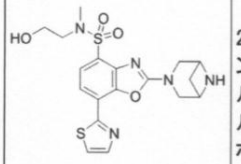
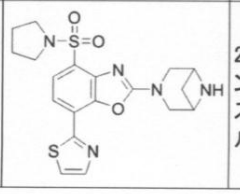
【０５９８】

【表５１】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
375		3-(5-クロロ-7-(チアゾール-2-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)-3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-オール	447 (M+H)+	(400 MHz) : 1.73-1.80 (m, 2H), 2.20-2.27 (m, 2H), 3.52-3.58 (m, 2H), 3.68-3.72 (m, 2H), 4.07-4.13 (m, 2H), 5.86 (brs, 1H), 7.51 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
376		(2-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)ピリジン-3-イル)メタノール	422 (M+H)+	(400 MHz) : 1.55 (d, J=8.9 Hz, 1H), 2.53-2.58 (m, 1H), 3.59-3.93 (m, 6H), 4.71 (brd, J=4.5 Hz, 2H), 5.43 (brt, J=5.2 Hz, 1H), 7.06 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.14 (dd, J=7.3, 5.0 Hz, 1H), 7.77 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.88-7.98 (m, 3H), 8.02 (d, J=3.3 Hz, 1H)	DMSO-d_6
377		1-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロプロパン-2,2-ジオール	425 (M+H)+	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.57 (s, 3H), 2.83-2.90 (m, 1H), 3.90-3.95 (m, 2H), 3.96-4.05 (m, 4H), 7.20-7.24 (m, 1H), 7.47 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.85 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
378		3-(7-(チアゾール-2-イル)-4-(2,2,2-トリフルオロ-1-ヒドロキシエチル)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)-3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-オール(光学活性体)	427 (M+H)+	(400 MHz) : 1.73-1.79 (m, 2H), 2.20-2.26 (m, 2H), 3.51-3.58 (m, 2H), 3.68-3.73 (m, 2H), 4.03-4.10 (m, 2H), 5.20 (q, J=7.0 Hz, 1H), 7.21 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.85 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
379		3-(7-(チアゾール-2-イル)-4-(2,2,2-トリフルオロ-1-ヒドロキシエチル)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)-3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-オール(実施例378の鏡像異性体)	427 (M+H)+	(400 MHz) : 1.73-1.79 (m, 2H), 2.20-2.26 (m, 2H), 3.51-3.58 (m, 2H), 3.68-3.73 (m, 2H), 4.03-4.10 (m, 2H), 5.19 (q, J=7.2 Hz, 1H), 7.21 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.85 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
380		3-(7-(チアゾール-2-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)-3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-6-オール	399 (M+H)+	(400 MHz) : 1.79 (d, J=9.8 Hz, 1H), 2.22-2.33 (m, 1H), 3.88 (d, J=12.5 Hz, 2H), 4.01 (brd, J=4.9 Hz, 2H), 4.29 (brd, J=12.1 Hz, 2H), 4.67 (s, 1H), 7.21 (dq, J=8.8, 1.5 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.87 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
381		3-(5-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)-7-(チアゾール-2-イル)-4-(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)-3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-オール	455 (M+H)+	(400 MHz) : 1.74-1.87 (m, 1H), 1.80 (s, 6H), 2.15-2.28 (m, 3H), 3.55 (brd, J=12.4 Hz, 2H), 3.65-3.73 (m, 2H), 4.08-4.19 (m, 2H), 5.13 (s, 1H), 7.54 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.01 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.22 (s, 1H)	$CDCl_3$
382		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	299 (M+H)+	(400 MHz) : 1.70 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.87 (dt, J=9.2, 6.2 Hz, 1H), 3.90-4.09 (m, 6H), 7.31 (t, J=7.9 Hz, 1H), 7.44-7.50 (m, 2H), 7.88 (dd, J=8.0, 1.1 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$

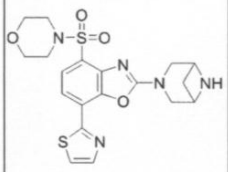
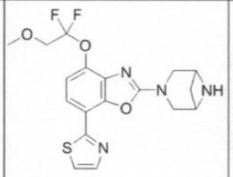
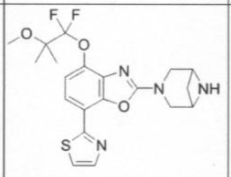
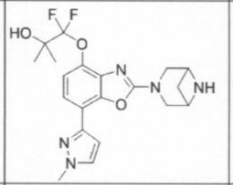
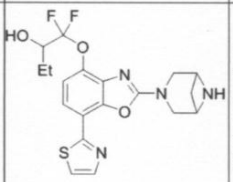
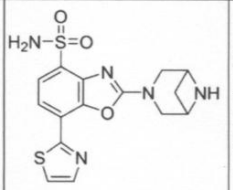
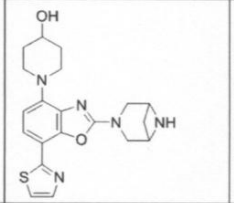
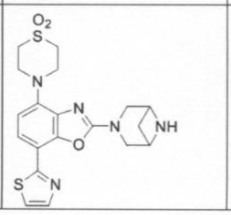
【０５９９】

【表５２】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
383		3-(5-(1-ヒドロキシエチル)-7-(チアゾール-2-イル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)-3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-オール	457 (M+H)+	(400 MHz) : 1.53-1.57 (m, 3H), 1.71-1.83 (m, 2H), 1.96 (brs, 1H), 2.16-2.32 (m, 2H), 3.54 (brd, J=12.2 Hz, 2H), 3.70 (brs, 2H), 4.05-4.13 (m, 2H), , 5.24 (s, 1H), 5.37 (q, J=6.2 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.12Hz, 1H), 7.98 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H)	$CDCl_3$
384		3-(5-(1-ヒドロキシエチル)-7-(チアゾール-2-イル)-4-(トリフルオロメチル)ベンゾ[d]オキサゾール-2-イル)-3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-8-オール	441 (M+H)+	(400 MHz) : 1.52-1.62 (m, 3H), 1.74-1.83 (m, 2H), 1.95-2.06 (m, 1H), 2.18-2.32 (m, 2H), 3.56 (brd, J=12.5 Hz, 2H), 3.70 (brs, 2H), 4.12 (brdd, J=12.8, 2.1 Hz, 2H), 5.20 (brs, 1H), 5.39-5.51 (m, 1H), 7.54 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.03 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H)	$CDCl_3$
385		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-N-(2-ヒドロキシエチル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-スルホンアミド	422 (M+H)+	(400 MHz) : 1.63 (d, J=8.9 Hz, 1H), 2.57-2.64 (m, 1H), 2.99-3.05 (m, 2H), 3.39-3.46 (m, 2H), 3.71-3.76 (m, 2H), 3.86-4.02 (m, 4H), 4.67 (t, J=5.6 Hz, 1H), 7.19 (t, J=5.9 Hz, 1H), 7.66 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.86 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.07 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.12 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6
386		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-N-メチル-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-スルホンアミド	392 (M+H)+	(400 MHz) : 1.63 (d, J=8.9 Hz, 1H), 2.56-2.64 (m, 4H), 3.70-3.75 (m, 2H), 3.87-4.02 (m, 4H), 7.17 (q, J=4.8 Hz, 1H), 7.66 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.86 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.07 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.12 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6
387		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-N-(2-メトキシエチル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-スルホンアミド	436 (M+H)+	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.5 Hz, 1H), 2.87-2.94 (m, 1H), 3.06-3.11 (m, 2H), 3.26 (s, 3H), 3.46 (t, J=5.1 Hz, 2H), 3.94-3.98 (m, 2H), 4.00-4.10 (m, 4H), 6.00 (brs, 1H), 7.56 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.78 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.92 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.02 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
388		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-N,N-ジメチル-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-スルホンアミド	406 (M+H)+	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.4 Hz, 1H), 2.86-2.94 (m, 7H), 3.92-3.97 (m, 2H), 4.00-4.10 (m, 4H), 7.56 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.76 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.92 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.02 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
389		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-N-(2-ヒドロキシエチル)-N-メチル-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-スルホンアミド	436 (M+H)+	(400 MHz) : 1.67 (d, J=9.4 Hz, 1H), 2.77 (s, 3H), 2.85-2.92 (m, 1H), 3.62-3.67 (m, 2H), 3.76-3.81 (m, 2H), 3.94-3.98 (m, 2H), 4.02-4.11 (m, 4H), 7.58 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.90 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.96 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.03 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
390		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(ピロリジン-1-イルスルホニル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	432 (M+H)+	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 1.77-1.83 (m, 4H), 2.86-2.92 (m, 1H), 3.55-3.61 (m, 4H), 3.92-3.96 (m, 2H), 3.99-4.09 (m, 4H), 7.55 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.82 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.91 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.02 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$

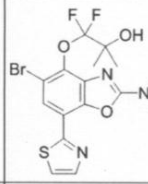
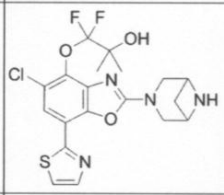
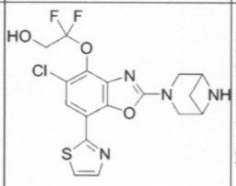
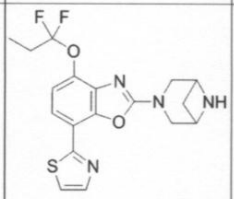
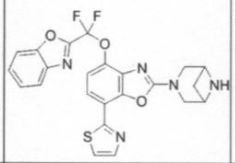
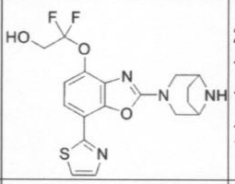
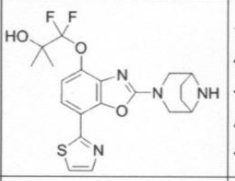
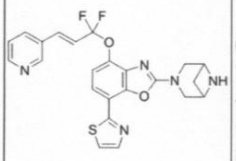
【０６００】

【表５３】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
391		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(モルホリノスルホニル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	448 (M+H)+	(400 MHz) : 1.70 (d, J=8.8 Hz, 1H), 2.87-2.94 (m, 1H), 3.32-3.36 (m, 4H), 3.71-3.76 (m, 4H), 3.95-3.99 (m, 2H), 4.01-4.10 (m, 4H), 7.57 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.74 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.93 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.03 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
392		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(1,1-ジフルオロ-2-メトキシエトキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	409 (M+H)+	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.81-2.92 (m, 1H), 3.62 (s, 3H), 3.92 (brd, J=5.9 Hz, 2H), 3.97-4.11 (m, 6H), 7.25-7.31 (m, 1H), 7.46 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.85 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
393		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(1,1-ジフルオロ-2-メトキシ-2-メチルプロポキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	437 (M+H)+	(400 MHz) : 1.54 (s, 6H), 1.68 (brd, J=9.3 Hz, 1H), 2.78-2.92 (m, 1H), 3.53 (s, 3H), 3.84-4.12 (m, 6H), 7.22-7.26 (m, 1H), 7.46 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.84 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
394		1-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(1-メチル-1H-ピラゾール-3-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	420 (M+H)+	(400 MHz) : 1.51 (s, 6H), 1.64 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.80-2.88 (m, 1H), 3.92-4.02 (m, 6H), 5.30 (s, 3H), 6.74 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.19 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.43 (d, J=2.2 Hz, 1H), 7.59 (d, J=8.6 Hz, 1H)	$CDCl_3$
395		1-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロブタン-2-オール	423 (M+H)+	(400 MHz) : 1.05 (t, J=6.0 Hz, 3H), 1.65-1.75 (m, 2H), 1.75-1.85 (m, 1H), 2.89 (brs, 1H), 3.73 (ddd, J=16.7, 9.3, 3.3 Hz, 1H), 3.90-4.10 (m, 6H), 7.24 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.47 (d, J=3.1 Hz, 1H), 7.85 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
396		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-スルホンアミド	378 (M+H)+	(400 MHz) : 1.63 (d, J=8.9 Hz, 1H), 2.58-2.65 (m, 1H), 3.72-3.77 (m, 2H), 3.90-4.02 (m, 4H), 7.23 (brs, 2H), 7.67 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.85 (d, J=8.4 Hz, 1H), 8.06 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.11 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6
397		1-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)ピペリジン-4-オール	398 (M+H)+	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 1.73-1.84 (m, 2H), 2.03-2.11 (m, 2H), 2.81-2.88 (m, 1H), 3.12-3.20 (m, 2H), 3.87-4.10 (m, 9H), 6.74 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.34 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.79 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.87 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
398		4-(2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)チオモルホリン 1,1-ジオキシド	432 (M+H)+	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.83-2.91 (m, 1H), 3.18-3.23 (m, 4H), 3.91-4.03 (m, 6H), 4.21-4.27 (m, 4H), 6.73 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.39 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.82 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.90 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$

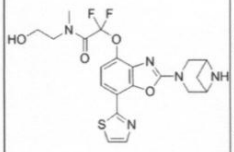
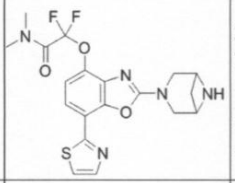
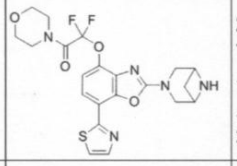
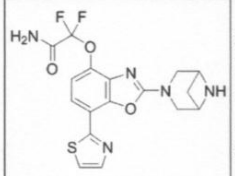
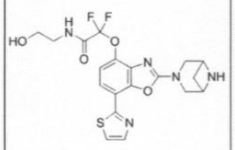
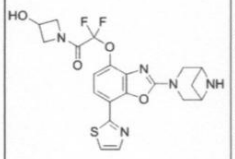
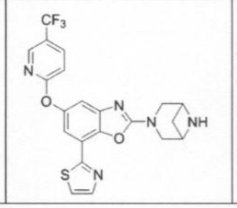
【０６０１】

【表５４】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
399		1-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-5-ブロモ-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	501 (M+H)+	(400 MHz) : 1.46 (s, 6H), 1.59 (d, J=8.4 Hz, 1H), 2.53-2.63 (m, 1H), 3.69 (brd, J=6.0 Hz, 2H), 3.74-3.99 (m, 4H), 5.58 (s, 1H), 7.97 (s, 1H), 8.01 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.07 (d, J=3.3 Hz, 1H)	DMSO-d_6
400		1-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-5-クロロ-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	457 (M+H)+	(400 MHz) : 1.40 (s, 6H), 1.53 (d, J=8.8 Hz, 1H), 2.52-2.57 (m, 1H), 3.63 (brd, J=6.0 Hz, 2H), 3.66-3.82 (m, 4H), 5.61 (s, 1H), 7.30 (s, 1H), 8.07 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.11 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6
401		2-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-5-クロロ-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-2,2-ジフルオロエタン-1-オール	429 (M+H)+	(400 MHz) : 1.53 (d, J=8.8 Hz, 1H), 2.53-2.58 (m, 1H), 3.63 (brd, J=6.0 Hz, 2H), 3.67-3.83 (m, 4H), 3.94 (td, J=10.5, 6.0 Hz, 2H), 5.99 (brt, J=6.6 Hz, 1H), 7.33 (s, 1H), 8.07 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.12 (d, J=3.3 Hz, 1H)	DMSO-d_6
402		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(1,1-ジフルオロプロポキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	393 (M+H)+	(400 MHz) : 1.24 (t, J=7.5 Hz, 3H), 1.68 (d, J=9.3 Hz, 2H), 2.23-2.41 (m, 2H), 2.80-2.92 (m, 1H), 3.92 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.96-4.11 (m, 4H), 7.25 (t, J=1.6 Hz, 1H), 7.45 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.84 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
403		4-(ベンゾ[d]オキサゾール-2-イルジフルオロメトキシ)-2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	482 (M+H)+	(400 MHz) : 1.60 (brd, J=9.2 Hz, 1H), 2.77-2.88 (m, 1H), 3.71-4.01 (m, 6H), 7.34 (brd, J=8.8 Hz, 1H), 7.41-7.56 (m, 3H), 7.68 (d, J=7.8 Hz, 1H), 7.87 (d, J=8.8 Hz, 2H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H)	DMSO-d_6
404		2-((2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-2,2-ジフルオロエタン-1-オール	409 (M+H)+	(400 MHz) : 1.84-1.97 (m, 4H), 3.48 (dd, J=12.2, 2.0 Hz, 2H), 3.66-3.75 (m, 2H), 3.79 (t, J=7.6 Hz, 2H), 3.97 (dd, J=11.9, 1.8 Hz, 2H), 5.85 (brs, 1H), 7.19-7.24 (m, 1H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.79-7.90 (m, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	CDCl3
405		1-((2-(3,8-ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-1,1-ジフルオロ-2-メチルプロパン-2-オール	437 (M+H)+	(400 MHz) : 1.53 (s, 6H), 1.82-1.96 (m, 4H), 3.43 (dd, J=12.2, 1.9 Hz, 2H), 3.68 (brs, 2H), 3.80 (brs, 1H), 3.99 (dd, J=12.1, 2.2 Hz, 2H), 7.19-7.26 (m, 1H), 7.45 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.82 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
406		(E)-2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-((1,1-ジフルオロ-3-(ピリジン-3-イル)アリル)オキシ)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	468 (M+H)+	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.2 Hz, 1H), 2.81-2.92 (m, 1H), 3.92 (brd, J=5.9 Hz, 2H), 3.96-4.10 (m, 4H), 6.58 (dt, J=16.2, 7.2 Hz, 1H), 7.28-7.37 (m, 3H), 7.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.80 (dt, J=8.0, 1.8 Hz, 1H), 7.87 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.59 (dd, J=4.8, 1.6 Hz, 1H), 8.71 (d, J=2.1 Hz, 1H)	$CDCl_3$

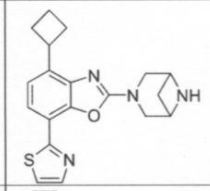
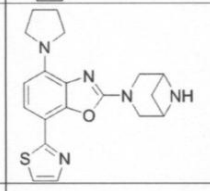
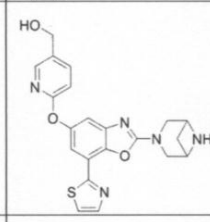
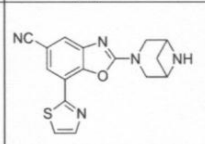
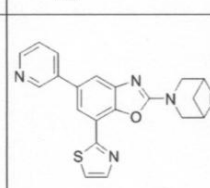
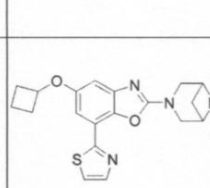
【０６０２】

【表５５】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
407		2-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-2,2-ジフルオロ-N-(2-ヒドロキシエチル)-N-メチルアセトアミド	466 (M+H)+	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.4 Hz, 1H), 2.84-2.97 (m, 1H), 3.12 (s, 2.7H), 3.54 (s, 0.3H), 3.62-3.70 (m, 0.4H), 3.79-4.12 (m, 10H), 5.48-5.59 (m, 0.6H), 7.38-7.45 (m, 1H), 7.46-7.51 (m, 1H), 7.83 (d, J=8.8 Hz, 0.1H), 7.90 (d, J=8.8 Hz, 0.9H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 0.1H), 7.98 (d, J=3.2 Hz, 0.9H)	$CDCl_3$
408		2-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-2,2-ジフルオロ-N,N-ジメチルアセトアミド	436 (M+H)+	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.83-2.91 (m, 1H), 3.09 (s, 3H), 3.44-3.48 (m, 3H), 3.92 (brd, J=5.9 Hz, 2H), 3.95-4.07 (m, 4H), 7.29-7.33 (m, 1H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.86 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
409		2-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-2,2-ジフルオロ-1-モルホリノエタン-1-オン	478 (M+H)+	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 2.83-2.94 (m, 1H), 3.71-3.86 (m, 6H), 3.90-4.05 (m, 6H), 4.13-4.22 (m, 2H), 7.29-7.34 (m, 1H), 7.48 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.86 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.97 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
410		2-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-2,2-ジフルオロアセトアミド	408 (M+H)+	(400 MHz) : 1.59 (brd, J=8.8 Hz, 1H), 2.54-2.63 (m, 1H), 3.69 (brd, J=5.9 Hz, 2H), 3.56-3.59 (m, 4H), 7.24 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.79 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.2 Hz, 1H), 8.24 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.25 (brs, 1H), 8.53 (brs, 1H)	DMSO-d_6
411		2-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-2,2-ジフルオロ-N-(2-ヒドロキシエチル)アセトアミド	452 (M+H)+	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.4 Hz, 1H), 2.83-2.95 (m, 1H), 3.53-3.60 (m, 2H), 3.79-3.87 (m, 2H), 3.89-4.06 (m, 6H), 7.25-7.30 (m, 1H), 7.46 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.83 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.94 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.20-8.30 (m, 1H)	$CDCl_3$
412		2-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-4-イル)オキシ)-2,2-ジフルオロ-1-(3-ヒドロキシアゼチジン-1-イル)エタン-1-オン	464 (M+H)+	(400 MHz) : 1.68 (brd, J=9.3 Hz, 1H), 2.88 (dt, J=9.1, 6.2 Hz, 1H), 3.93 (brd, J=6.0 Hz, 2H), 4.00 (s, 4H), 4.05 (ddd, J=11.4, 3.9, 1.3 Hz, 1H), 4.43 (ddd, J=11.3, 6.7, 1.0 Hz, 1H), 4.54-4.64 (m, 1H), 4.68-4.80 (m, 1H), 4.89 (brdd, J=10.6, 6.4 Hz, 1H), 7.18-7.25 (m, 1H), 7.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.79 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.96 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
413		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)-5-((5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)オキシ)ベンゾ[d]オキサゾール	460 (M+H)+	(400 MHz) : 1.50-1.80 (m, 1H), 2.85-2.95 (m, 1H), 3.80-4.30 (m, 6H), 7.05 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.25 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.49 (d, J=3.6 Hz, 1H), 7.68 (d, J=2.4 Hz, 1H), 7.90 (dd, J=8.8, 2.0 Hz, 1H), 7.94 (d, J=3.6 Hz, 1H), 8.43 (brs, 1H)	$CDCl_3$

【０６０３】

【表５６】

実施例	構造式	化合物名	ESI MS m/z	^{1}H NMR、δ (ppm)	重溶媒
414		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-シクロブチル-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	353 (M+H)+	(400 MHz) : 1.68 (d, J=9.2 Hz, 1H), 1.89-1.98 (m, 1H), 2.05-2.14 (m, 1H), 2.28-2.49 (m, 4H), 2.81-2.88 (m, 1H), 3.91-4.09 (m, 7H), 7.25 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.41 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.84 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.93 (d, J=3.2 Hz, 1H)	$CDCl_3$
415		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-4-(ピロリジン-1-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	368 (M+H)+	(400 MHz) : 1.69 (d, J=9.3 Hz, 1H), 1.97-2.02 (m, 4H), 2.83-2.90 (m, 1H), 3.70-3.76 (m, 4H), 3.94-4.01 (m, 6H), 6.39 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.25 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.75 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.82 (d, J=3.3 Hz, 1H)	$CDCl_3$
416		(6-((2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-5-イル)オキシ)ピリジン-3-イル)メタノール	422 (M+H)+	(400 MHz) : 1.70 (d, J=9.0 Hz, 1H), 2.88 (m, 1H), 3.94 (d, J=6.2 Hz, 2H), 3.97-4.07 (m, 4H), 4.65 (s, 2H), 6.95 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.24 (d, J=2.1 Hz, 1H), 7.48 (d, J=3.4 Hz, 1H), 7.65 (d, J=2.1 Hz, 1H), 7.74 (dd, J=8.6, 2.4 Hz, 1H), 7.93 (d, J=2.8 Hz, 1H), 8.15 (d, J=2.8 Hz, 1H)	$CDCl_3$
417		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール-5-カルボニトリル	324 (M+H)+	(400 MHz) : 1.71 (d, J=9.0 Hz, 1H), 2.91 (m, 1H), 3.97 (d, J=6.2 Hz, 2H), 3.98-4.08 (m, 4H), 7.55 (d, J=2.8 Hz, 1H), 7.64-7.66 (m, 1H), 8.01 (d, J=3.4 Hz, 1H), 8.22-8.24 (m, 1H)	$CDCl_3$
418		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-5-(ピリジン-3-イル)-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	376 (M+H)+	(400 MHz) : 1.74 (d, J=9.6 Hz, 1H), 2.88-2.94 (m, 1H), 3.97 (d, J=5.5 Hz, 2H), 4.02-4.10 (m, 4H), 7.42 (q, J=4.4 Hz, 1H), 7.54 (d, J=3.4 Hz, 1H), 7.65 (d, J=2.1 Hz, 1H), 7.98-8.03 (m, 2H), 8.10 (d, J=1.4 Hz, 1H), 8.57-8.03 (m, 1H), 8.92 (d, J=2.1 Hz, 1H)	$CDCl_3$
419		2-(3,6-ジアザビシクロ[3.1.1]ヘプタン-3-イル)-5-シクロブトキシ-7-(チアゾール-2-イル)ベンゾ[d]オキサゾール	369 (M+H)+	(400 MHz) : 1.65-1.74 (m, 2H), 1.82-1.92 (m, 1H), 2.16-2.27 (m, 2H), 2.47-2.56 (m, 2H), 2.82-2.89 (m, 1H), 3.90-3.94 (m, 2H), 3.95-4.04 (m, 4H), 4.69-4.77 (m, 1H), 6.96 (d, J=2.1 Hz, 1H), 7.34 (d, J=2.1 Hz, 1H), 7.46 (d, J=3.1 Hz, 1H), 7.95 (d, J=3.8 Hz, 1H)	$CDCl_3$

【０６０４】

（試験例１　ＰＤＥ４阻害活性評価）

ＰＤＥ４阻害活性はシンチレーション近接アッセイ（Ｓｃｉｎｔｉｌｌａｔｉｏｎ　Ｐｒｏｘｉｍｉｔｙ　Ａｓｓａｙ（ＳＰＡ））を用いて、以下のようにして測定した。先ず、ジメチルスルホキシドに溶解した被験化合物を５０ｍＭ　Ｔｒｉｓ－ＨＣｌ，ｐＨ７．４，８．３ｍＭ　$MgCl_2$，１．７ｍＭ　ＥＧＴＡ，３ｍｇ／ｍＬ　ウシ血清アルブミン（ＢＳＡ）を含む反応用緩衝溶液で１０倍希釈したものを、９６ウェルのアッセイプレートに１０μＬ加えた。さらに、反応用緩衝溶液で３７５倍希釈したＰＤＥ４（酵素標品）を５０μＬ加えた後、反応用緩衝溶液で１０００倍希釈した［２，８－^{3}Ｈ］－Ａｄｅｎｏｓｉｎｅ－３’，５’－ｃｙｃｌｉｃ　ｐｈｏｓｐｈａｔｅ　ｔｒｉｅｔｈｙｌａｍｍｏｎｉｕｍ　ｓａｌｔを４０μＬ加え、室温で１２０分間静置した。その後、２００ｍＭの$ZnSO_4$を含むＲＮＡ　ｂｉｎｄｉｎｇ　ＹＳｉ－ＳＰＡ　Ｂｅａｄｓ懸濁液を５０μＬ加え、室温で１５分間静置して、酵素反応生成物をＢｅａｄｓに吸着させた。その後、９６ウェルプレート用液体シンチレーションカウンターにて放射活性を計測した。酵素標品を加えずに反応用緩衝溶液のみを加えたものをブランク、酵素標品を加えるが被験化合物に代えてジメチルスルホキシドのみを加えたものをコントロールとし、被験化合物のコントロールに対する阻害率を以下の計算式により計算した。

阻害率（％）＝｛１－（各被験化合物添加時の数値－ブランク値）／（コントロール値－ブランク値）｝×１００
また、被験化合物のＰＤＥ４阻害活性（ＰＤＥ４活性を５０％阻害する濃度＝５０％阻害率における濃度（ＩＣ５０））は、被験化合物の各濃度における阻害率に基づく阻害曲線から算出した。

【０６０５】
上記の方法により、被験化合物のＰＤＥ４阻害活性（５０％阻害率における濃度）を測定して得られた測定結果を、Ａ：１００ｎＭ未満、Ｂ：１００ｎＭ以上１０００ｎＭ未満、Ｃ：１０００ｎＭ以上、の基準に従って評価した（評価１）。各実施例で得られた化合物を被験化合物としたときの評価１の結果を表５７～表６８に示す。

【０６０６】
また、評価１の結果がＡであった化合物について、ＰＤＥ４阻害活性（５０％阻害率における濃度）を測定して得られた測定結果を、ＡＡ：１ｎＭ以下、ＡＢ：１ｎＭを超えて１１ｎＭ以下、ＡＣ：１１ｎＭを超えて１００ｎＭ未満、に従ってさらに評価した（評価２）。各実施例で得られた化合物を被験化合物としたときの評価２の結果を表６９に示す。また、表６９には、被験化合物としてアプレミラスト又はクリサボロールを用いて得られた結果を合わせて示す。なお、表６９中、「１００＜」は、ＰＤＥ４阻害活性（５０％阻害率における濃度）を測定して得られた測定結果が１００ｎＭ以上であったことを示す。

【０６０７】
【表５７】

被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性
実施例1	A	実施例13	A	実施例25	A
実施例2	A	実施例14	B	実施例26	A
実施例3	A	実施例15	A	実施例27	A
実施例4	A	実施例16	A	実施例28	A
実施例5	A	実施例17	A	実施例29	A
実施例6	A	実施例18	B	実施例30	A
実施例7	A	実施例19	A	実施例31	A
実施例8	A	実施例20	A	実施例32	A
実施例9	A	実施例21	A	実施例33	A
実施例10	A	実施例22	A	実施例34	A
実施例11	A	実施例23	B	実施例35	B
実施例12	A	実施例24	A	実施例36	A

【０６０８】

【表５８】

被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性
実施例37	A	実施例49	B	実施例61	A
実施例38	A	実施例50	A	実施例62	A
実施例39	A	実施例51	A	実施例63	A
実施例40	A	実施例52	A	実施例64	A
実施例41	A	実施例53	A	実施例65	A
実施例42	A	実施例54	A	実施例66	A
実施例43	A	実施例55	A	実施例67	A
実施例44	A	実施例56	A	実施例68	A
実施例45	A	実施例57	A	実施例69	A
実施例46	A	実施例58	A	実施例70	A
実施例47	A	実施例59	A	実施例71	A
実施例48	A	実施例60	A	実施例72	A

【０６０９】

【表５９】

被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性
実施例73	A	実施例85	A	実施例97	A
実施例74	A	実施例86	A	実施例98	A
実施例75	A	実施例87	A	実施例99	A
実施例76	A	実施例88	B	実施例100	A
実施例77	A	実施例89	A	実施例101	A
実施例78	A	実施例90	B	実施例102	A
実施例79	A	実施例91	C	実施例103	A
実施例80	A	実施例92	C	実施例104	A
実施例81	A	実施例93	B	実施例105	A
実施例82	A	実施例94	A	実施例106	A
実施例83	A	実施例95	A	実施例107	B
実施例84	A	実施例96	A	実施例108	A

【０６１０】

【表６０】

被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性
実施例109	A	実施例121	A	実施例133	A
実施例110	A	実施例122	A	実施例134	A
実施例111	A	実施例123	A	実施例135	A
実施例112	A	実施例124	A	実施例136	A
実施例113	A	実施例125	A	実施例137	A
実施例114	A	実施例126	A	実施例138	A
実施例115	A	実施例127	A	実施例139	A
実施例116	A	実施例128	A	実施例140	A
実施例117	A	実施例129	A	実施例141	A
実施例118	A	実施例130	A	実施例142	A
実施例119	A	実施例131	A	実施例143	A
実施例120	A	実施例132	A	実施例144	A

【０６１１】

【表６１】

被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性
実施例145	A	実施例157	A	実施例169	A
実施例146	A	実施例158	B	実施例170	A
実施例147	A	実施例159	A	実施例171	A
実施例148	A	実施例160	A	実施例172	A
実施例149	A	実施例161	A	実施例173	A
実施例150	A	実施例162	A	実施例174	A
実施例151	A	実施例163	A	実施例175	A
実施例152	A	実施例164	A	実施例176	A
実施例153	A	実施例165	A	実施例177	A
実施例154	A	実施例166	A	実施例178	A
実施例155	A	実施例167	A	実施例179	A
実施例156	A	実施例168	A	実施例180	A

【０６１２】

【表６２】

被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性
実施例181	A	実施例193	A	実施例205	A
実施例182	A	実施例194	B	実施例206	A
実施例183	A	実施例195	A	実施例207	A
実施例184	A	実施例196	A	実施例208	A
実施例185	A	実施例197	A	実施例209	A
実施例186	A	実施例198	A	実施例210	A
実施例187	A	実施例199	A	実施例211	A
実施例188	A	実施例200	A	実施例212	A
実施例189	B	実施例201	A	実施例213	A
実施例190	C	実施例202	A	実施例214	A
実施例191	B	実施例203	A	実施例215	A
実施例192	A	実施例204	A	実施例216	A

【０６１３】

【表６３】

被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性
実施例217	A	実施例229	A	実施例241	A
実施例218	A	実施例230	A	実施例242	A
実施例219	A	実施例231	A	実施例243	A
実施例220	A	実施例232	A	実施例244	A
実施例221	A	実施例233	A	実施例245	A
実施例222	A	実施例234	A	実施例246	A
実施例223	A	実施例235	A	実施例247	A
実施例224	A	実施例236	A	実施例248	A
実施例225	A	実施例237	A	実施例249	A
実施例226	A	実施例238	A	実施例250	A
実施例227	A	実施例239	A	実施例251	A
実施例228	A	実施例240	A	実施例252	A

【０６１４】

【表６４】

被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性
実施例253	A	実施例265	A	実施例277	A
実施例254	A	実施例266	A	実施例278	A
実施例255	A	実施例267	A	実施例279	A
実施例256	A	実施例268	A	実施例280	A
実施例257	A	実施例269	A	実施例281	A
実施例258	A	実施例270	A	実施例282	A
実施例259	A	実施例271	A	実施例283	A
実施例260	A	実施例272	A	実施例284	A
実施例261	A	実施例273	A	実施例285	A
実施例262	A	実施例274	A	実施例286	A
実施例263	A	実施例275	A	実施例287	A
実施例264	A	実施例276	A	実施例288	A

【０６１５】

【表６５】

被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性
実施例289	A	実施例301	A	実施例313	A
実施例290	A	実施例302	A	実施例314	A
実施例291	A	実施例303	A	実施例315	A
実施例292	A	実施例304	A	実施例316	A
実施例293	A	実施例305	A	実施例317	A
実施例294	A	実施例306	B	実施例318	A
実施例295	A	実施例307	A	実施例319	A
実施例296	A	実施例308	A	実施例320	A
実施例297	A	実施例309	A	実施例321	A
実施例298	A	実施例310	A	実施例322	A
実施例299	A	実施例311	A	実施例323	A
実施例300	A	実施例312	A	実施例324	A

【０６１６】

【表６６】

被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性
実施例325	A	実施例337	A	実施例349	A
実施例326	A	実施例338	A	実施例350	A
実施例327	A	実施例339	A	実施例351	A
実施例328	A	実施例340	A	実施例352	A
実施例329	A	実施例341	A	実施例353	A
実施例330	A	実施例342	A	実施例354	A
実施例331	A	実施例343	A	実施例355	A
実施例332	A	実施例344	A	実施例356	B
実施例333	B	実施例345	A	実施例357	A
実施例334	A	実施例346	A	実施例358	A
実施例335	A	実施例347	A	実施例359	B
実施例336	A	実施例348	A	実施例360	B

【０６１７】

【表６７】

被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性
実施例361	A	実施例373	A	実施例385	A
実施例362	A	実施例374	A	実施例386	A
実施例363	A	実施例375	A	実施例387	A
実施例364	A	実施例376	A	実施例388	A
実施例365	A	実施例377	A	実施例389	A
実施例366	B	実施例378	B	実施例390	A
実施例367	A	実施例379	A	実施例391	A
実施例368	B	実施例380	A	実施例392	A
実施例369	A	実施例381	C	実施例393	A
実施例370	A	実施例382	A	実施例394	B
実施例371	A	実施例383	C	実施例395	A
実施例372	A	実施例384	C	実施例396	A

【０６１８】

【表６８】

被検化合物	PDE4阻害活性	被検化合物	PDE4阻害活性
実施例397	A	実施例407	A
実施例398	A	実施例408	A
実施例399	A	実施例409	A
実施例400	A	実施例410	A
実施例401	A	実施例411	A
実施例402	A	実施例412	A
実施例403	A	実施例413	A
実施例404	A	実施例414	A
実施例405	A	実施例415	A
実施例406	A		

【０６１９】

【表６９】

実施例	PDE4阻害活性(評価2)
実施例3	AA
実施例4	AB
実施例25	AA
実施例29	AB
実施例30	AA
実施例32	AB
実施例75	AB
実施例118	AB
実施例119	AA
実施例120	AB
実施例176	AB
実施例177	AB
実施例195	AA
実施例198	AA
実施例199	AB
実施例203	AB
実施例208	AB
実施例212	AA
実施例234	AA
実施例235	AA
実施例248	AA
実施例249	AA
実施例251	AA
実施例252	AA
実施例296	AB
アプレミラスト	AC
クリサボロール	100<

【０６２０】

（試験例２　肝代謝安定性評価（ラット肝マイクロソーム法））

ラット肝マイクロソームにおける代謝に対する安定性は以下の方法で評価した。先ず、１００ｍＭリン酸カリウム緩衝液（ｐＨ７．４）中において、肝ミクロソーム（反応時濃度０．５ｍｇ／ｍＬ）、被験化合物（反応時濃度１μＭ）を３７度にてプレインキュベーションした。５分後、ＮＡＤＰＨ（反応時濃度１ｍＭ）の１００ｍＭリン酸カリウム緩衝（ｐＨ７．４）溶液を混合し反応を開始した。一定時間経過後、反応溶液にアセトニトリルを混合し反応を停止した。なお、反応時間は０及び３０分とし、各時間における薬物濃度測定をＬＣ－ＭＳにて測定し、０分の値と３０分の値から被験化合物の残存率を以下の計算式により計算した。

残存率（％）＝（３０分の値／０分の値）×１００

上記の方法により、被験化合物のラット肝マイクロソーム代謝安定性（反応３０分における残存率）を測定した。測定結果は、Ａ：残存率７５％以上、Ｂ：６０％以上７５％未満、Ｃ：４５％以上６０％未満、Ｄ：４５％未満の基準に従って評価した。各実施例で得られた化合物を被験化合物としたときの評価結果を表７０に示す。

【０６２１】

【表７０】

被験化合物	残存率	被験化合物	残存率	被験化合物	残存率
実施例3	B	実施例326	A	実施例359	A
実施例5	B	実施例327	B	実施例360	A
実施例8	A	実施例328	A	実施例363	A
実施例10	A	実施例329	A	実施例364	A
実施例12	B	実施例330	A	実施例365	A
実施例17	B	実施例331	B	実施例369	B
実施例29	B	実施例332	A	実施例370	A
実施例104	B	実施例333	B	実施例372	B
実施例230	A	実施例334	B	実施例373	B
実施例231	A	実施例335	A	実施例374	B
実施例248	A	実施例336	B	実施例376	A
実施例249	B	実施例337	B	実施例382	B
実施例251	A	実施例338	A	実施例385	A
実施例252	A	実施例339	B	実施例387	A
実施例254	A	実施例340	A	実施例391	B
実施例259	A	実施例341	A	実施例392	B
実施例285	A	実施例342	B	実施例394	A
実施例294	A	実施例343	B	実施例395	B
実施例304	A	実施例346	A	実施例397	A
実施例306	A	実施例347	A	実施例399	B
実施例315	A	実施例348	B	実施例400	B
実施例316	A	実施例349	A	実施例401	A
実施例317	A	実施例350	A	実施例404	B
実施例318	B	実施例352	A	実施例405	B
実施例319	A	実施例353	A	実施例409	B
実施例321	A	実施例354	A	実施例410	A
実施例322	A	実施例355	A	実施例411	A
実施例323	B	実施例356	A	実施例412	A
実施例324	A	実施例357	A	実施例413	A
実施例325	A	実施例358	A		

【０６２２】

各実施例で得られた化合物を被験化合物として、以下の試験例３～１２により、該被験化合物を含有する治療剤の抗炎症効果、抗自己免疫効果、抗線維化効果、及び抗がん効果を評価した。

【０６２３】
（試験例３　ヒト全血を用いたサイトカイン（ＴＮＦα、ＩＬ－１７Ａ、ＩＬ－４、ＩＬ－５）抑制評価）
９６ウェルプレートにジメチルスルホキシドに溶解した被験化合物を添加し、ＲＰＭＩ－１６４０培地及びヘパリンナトリウム入りヒト末梢血を加えて３７℃、５％CO_2下で１時間培養した。コントロールウェルには、被験化合物に代えてジメチルスルホキシドのみを添加した培地を加えた。ＴＮＦα産生刺激剤として各ウェルにリポポリサッカライド（最終濃度１０ｎｇ／ｍＬ）、又はＩＬ－１７Ａ産生刺激剤としてフィトヘマグルチニン（最終濃度２０μｇ／ｍＬ）、又はＩＬ－４産生刺激剤、ＩＬ－５産生刺激剤としてＣｙｔｏＳｔｉｍ試薬（１/１００濃度）及びＣＤ２８抗体（最終濃度２.５ｎｇ/ｍＬ）を加え、３７℃、５％CO_2下で培養した。ＴＮＦα量を評価する際は約１８時間、ＩＬ－１７Ａ量、ＩＬ－４量、及びＩＬ－５量を評価する際はそれぞれ約４８時間培養した。
【０６２４】
培養後の培養上清を回収後、サンドイッチＥＬＩＳＡ法にて各サイトカイン量を測定した。被験化合物によるサイトカイン産生抑制率（阻害率）は、コントロールウェルのサイトカイン産生量を１００％とし、被験化合物添加時のサイトカイン産生量から、以下の計算式により算出した。
阻害率（％）＝｛１－（各被験化合物添加時のサイトカイン量）／（コントロールウェルのサイトカイン量）｝×１００
また、被験化合物のサイトカイン阻害活性（５０％阻害率における濃度）は、被験化合物の各濃度における阻害率に基づく阻害曲線から算出した。
【０６２５】
上記の方法により各被験化合物のＴＮＦα阻害活性、ＩＬ－５阻害活性（５０％阻害濃度）を測定して得られた測定結果を、Ａ：１００ｎＭ未満、Ｂ：１００ｎＭ以上５００ｎＭ未満、Ｃ：５００ｎＭ以上、の基準に従って評価した。また、各被験化合物のＩＬ－１７Ａ阻害活性、ＩＬ－４阻害活性（５０％阻害濃度）を測定して得られた測定結果を、Ａ：５００ｎＭ未満、Ｂ：５００ｎＭ以上５０００ｎＭ未満、Ｃ：５０００ｎＭ以上、の基準に従って評価した。
【０６２６】
（試験例４　ヒト末梢血単核細胞を用いたサイトカイン（ＴＮＦα、ＩＬ－１７Ａ、ＩＬ－２３、ＩＬ－４、ＩＬ－５、ＩＬ－１３）抑制評価）
先ず、比重遠心分離法により、全血から末梢血単核細胞（ＰＢＭＣ）を分離した。次いで、ＲＰＭＩ－１６４０培地（１０％ウシ胎児血清、ペニシリン、ストレプトマイシン、Ｌ－グルタミン、２－メルカプトエタノール含有）に分離した末梢血単核細胞を加え、９６ウェルプレートにて３７℃、５％CO_2下で０～１時間培養した。各ウェルにジメチルスルホキシドに溶解した被験化合物を添加し、さらに３７℃、５％CO_2下で１時間培養した。コントロールウェルには、被験化合物に代えてジメチルスルホキシドのみを添加した培地を加えた。ＴＮＦα産生刺激剤、ＩＬ－２３産生刺激剤として各ウェルにリポポリサッカライド（最終濃度１ｎｇ／ｍＬ）、又はＩＬ－１７Ａ産生刺激剤としてコンカナバリンＡ（最終濃度２０μｇ／ｍＬ）を加え、３７℃、５％CO_2下で培養した。また、ＩＬ－４産生刺激、ＩＬ－５産生刺激、ＩＬ－１３産生刺激として、あらかじめＣＤ３抗体（最終濃度３μｇ／ｍＬ）をコーティングした９６ウェルプレートにＰＢＭＣを播種し、ＣＤ２８抗体（最終濃度５ｎｇ/ｍＬ）を加えた。ＴＮＦα量及びＩＬ－２３量を評価する際はそれぞれ約１８時間、ＩＬ－１７Ａ量、ＩＬ－４量、ＩＬ－５量、及びＩＬ－１３量を評価する際はそれぞれ約４８時間、培養した。培養後の培養上清を回収後、サンドイッチＥＬＩＳＡ法にて、試験例３と同様に、各サイトカイン量を測定し、各被験化合物によるサイトカイン産生抑制率（阻害率）及びサイトカイン阻害活性（５０％阻害率における濃度）を算出した。
【０６２７】
上記の方法により各被験化合物のＴＮＦα阻害活性、ＩＬ－５阻害活性（５０％阻害濃

度）を測定して得られた測定結果を、Ａ：１０ｎＭ未満、Ｂ：１０ｎＭ以上１００ｎＭ未満、Ｃ：１００ｎＭ以上、の基準に従って評価した。また、各被験化合物のＩＬ－１７Ａ阻害活性、ＩＬ－２３阻害活性、ＩＬ－４阻害活性、ＩＬ－１３阻害活性（５０％阻害濃度）を測定して得られた測定結果を、Ａ：５００ｎＭ未満、Ｂ：５００ｎＭ以上５０００ｎＭ未満、Ｃ：５０００ｎＭ以上、の基準に従って評価した。

【０６２８】

（試験例５　ヒトＴ細胞を用いたサイトカイン（ＴＮＦα、ＩＬ－１７Ａ、ＩＬ－５、ＩＬ－１３）抑制評価）

先ず、ＥａｓｙＳｅｐ細胞分離Ｋｉｔを用いた磁気ビーズ法により、全血からＣＤ３陽性Ｔ細胞を分離した。あらかじめＣＤ３抗体（最終濃度３μｇ／ｍＬ）をコーティングした９６ウェルプレートに、ＲＰＭＩ－１６４０培地に懸濁した分離Ｔ細胞を播種した。さらにＩＬ－５産生刺激、ＩＬ－１３産生刺激としてＣＤ２８抗体（最終濃度５ｎｇ/ｍＬ）を加えた。各ウェルにジメチルスルホキシドに溶解した被験化合物を添加し、３７℃、５％CO_2下で培養した。ＴＮＦα量を評価する際は約１８時間、ＩＬ－１７Ａ量、ＩＬ－５量、及びＩＬ－１３量を評価する際はそれぞれ約４８時間培養した。コントロールウェルには、被験化合物に代えてジメチルスルホキシドのみを添加した培地を加えた。試験例３と同様に、各サイトカイン量を測定し、各被験化合物によるサイトカイン産生抑制率（阻害率）及びサイトカイン阻害活性（５０％阻害率における濃度）を算出した。

【０６２９】

上記の方法により各被験化合物のＴＮＦα阻害活性（５０％阻害濃度）を測定して得られた測定結果を、Ａ：１０ｎＭ未満、Ｂ：１０ｎＭ以上１００ｎＭ未満、Ｃ：１００ｎＭ以上、の基準に従って評価した。また、各被験化合物のＩＬ－１７Ａ阻害活性、ＩＬ－５阻害活性、ＩＬ－１３阻害活性阻害活性（５０％阻害濃度）を測定して得られた測定結果を、Ａ：５００ｎＭ未満、Ｂ：５００ｎＭ以上５０００ｎＭ未満、Ｃ：５０００ｎＭ以上、の基準に従って評価した。

【０６３０】

試験例３～５で得られたＴＮＦα阻害活性の結果を表７１に示す。なお、表７１には、被験化合物としてアプレミラスト又はクリサボロールを用いて得られた結果を合わせて示す。また、被験化合物として実施例２４８で得られた化合物を用いて試験例３～５で得られた各ＩＬ阻害活性の結果を表７２に示す。なお、表７２には、被験化合物としてアプレミラストを用いて得られた結果を合わせて示す。

【０６３１】

【表７１】

実施例	TNFα阻害活性		
	ヒト全血（試験例3）	ヒトPBMC（試験例4）	ヒトT細胞（試験例5）
実施例29	A	－	－
実施例118	B	－	－
実施例119	A	A	－
実施例176	B	－	－
実施例195	B	－	－
実施例198	B	－	－
実施例248	A	A	A
実施例249	A	－	－
実施例251	A	－	－
実施例252	A	A	－
アプレミラスト	C	B	C
クリサボロール	－	C	－

【０６３２】

【表７２】

阻害活性	ヒト全血（試験例3）		ヒトPBMC（試験例4）		ヒトT細胞（試験例5）	
	実施例248	アプレミラスト	実施例248	アプレミラスト	実施例248	アプレミラスト
IL-17A	A	C	A	B	A	B
IL-23	－	－	A	C	－	－
IL-4	A	C	A	C	－	－
IL-5	A	C	A	C	A	C
IL-13	－	－	A	C	A	B

【０６３３】

（試験例６　ＴＧＦ－β阻害活性評価）

ＴＧＦ－β阻害活性は、ＴＨＰ１細胞を用いて以下のように測定した。先ず、２４ウェル培養プレートにＴＨＰ１細胞を１×１０^{5}ｃｅｌｌｓ／ウェルで播種し、１００ｎＭホルボールミリステートアセテートを添加したＲＰＭＩ－１６４０培地（１０％ウシ胎児血清、ペニシリン、ストレプトマイシン含有）で３７℃、５％CO_2下にて一晩培養後、ホルボールミリステートアセテート非添加のＲＰＭＩ－１６４０培地に変えて３７℃、５％CO_2下にてさらに一晩培養することでマクロファージ様に分化させた。次いで、上記ＴＨＰ１培養プレートをＰＢＳ（－）１ｍＬ／ウェルにて１回洗浄後、被験化合物及びリポポリサッカライド（最終濃度１μｇ／ｍＬ）を添加し、３７℃、５％CO_2下にて約７時間培養した。培養後、培地を全量回収し、遠心分離した上清中のＴＧＦ‐β量をサンドイッチＥＬＩＳＡ法にて定量した。リポポリサッカライド非添加をブランク、被験化合物に代えてジメチルスルホキシドのみを添加したものをコントロールとし、被験化合物のコントロールに対する阻害率を以下の計算式により計算した。

阻害率（％）＝｛１－（各被験化合物添加時の数値－ブランク値）／（コントロール値－ブランク値）｝×１００

また、被験化合物のＴＧＦ－β阻害活性（５０％阻害率における濃度）は、被験化合物の各濃度における阻害率に基づく阻害曲線から算出した。

【０６３４】
上記の方法により各被験化合物のＴＦＧ－β阻害活性（５０％阻害濃度）を測定して得られた測定結果を、Ａ：１μＭ未満、Ｂ：１μＭ以上、の基準に従って評価した。結果を表７３に示す。なお、表７３には、被験化合物としてアプレミラストを用いて得られた結果を合わせて示す。
【０６３５】
【表７３】

実施例	TGF－β阻害活性(試験例6)
実施例3	A
実施例4	A
実施例25	A
実施例29	A
実施例30	A
実施例32	A
実施例75	A
実施例120	A
実施例177	A
実施例195	A
実施例199	A
実施例203	A
実施例248	A
アプレミラスト	B

【０６３６】
（試験例７　抗腫瘍活性評価）
抗腫瘍活性として、各種がん細胞（ＣＥＭ－Ｃ１（血液癌（白血病））、ＳＵ－ＤＨＬ－４（血液癌（リンパ腫））、Ａ５４９（肺がん）、ＨＣＴ－１１６（大腸がん）、Ｄａｏｙ（脳腫瘍））の５０％増殖阻害濃度を以下のように算出した。先ず、上記がん細胞をそれぞれ３８４ウェルプレートに播種し、３７℃、５％CO_2下にて一晩培養した後、翌日に被験化合物を各種濃度にて添加し、５日間培養後に各細胞数を測定した。測定される細胞数が、被験化合物非添加にて同条件で５日間培養後の細胞数と播種時（培養開始前）の細胞数との中間値となる被験化合物濃度を５０％増殖阻害濃度とした。上記の方法により各被験化合物の５０％増殖阻害濃度を測定して得られた測定結果を、Ａ：１０μＭ未満、Ｂ：１０μＭ以上５０μＭ未満、Ｃ：５０μＭ以上、の基準に従って評価した。被験化合物としてアプレミラストを用いた結果、いずれのがん細胞においても評価はＣであったのに対して、被験化合物として実施例２４８で得られた化合物を用いた結果、いずれのがん細胞においても評価はＡであった。
【０６３７】
（試験例８　ハプテン反復塗布マウス慢性皮膚炎モデル（経口、外用））
雌性ＢＡＬＢ／ｃマウス（７～８週齢）を用いて評価を行った。先ず、マウス腹部の体毛をバリカンで処理後、ハプテンとして３％オキサゾロン・アセトン／エタノール溶液１５０μＬを腹部に塗布した。その１週間後から３回／週ペースで１％オキサゾロン・アセトン／エタノール溶液２０μＬ／耳をマウス両耳の耳介外側表面部に塗布し、炎症を惹起した。炎症惹起開始１週間後から１０日間、隔日で１％オキサゾロン・アセトン／エタノ

ール溶液を塗布した。また、炎症惹起開始１週間後から１０日間、０．５％ｗ／ｖメチルセルロース（０．５％ＭＣ）に懸濁させた被験化合物を１日２回０．３～１０ｍｇ／ｋｇ経口投与（１０μＬ／ｇ）、又は、アセトン／エタノール溶液に溶解させた０．３～３％の被験化合物を１日１～２回２０μＬ塗布（外用投与）した。１％オキサゾロン非塗布をブランク、１％オキサゾロンを塗布し被験化合物を用いず０．５％ＭＣのみを経口投与、又は、アセトン／エタノール溶液のみを塗布したものをコントロールとした。

【０６３８】

１０日間の投与後、ダイヤルシックネスゲージを用いて耳介厚測定を行い、治療前（被験化合物投与開始直前）と治療後（１０日間被験化合物投与後）の耳介厚変化より、下記の計算式により浮腫抑制率を算出した。

浮腫抑制率（％）＝｛１－（被験化合物による治療後の耳介厚‐被験化合物による治療前の耳介厚）／（コントロールの治療後の耳介厚‐コントロールの治療前の耳介厚）｝×１００

上記の方法により各被験化合物の経口投与時の浮腫抑制率を測定して得られた測定結果を、Ａ：７０％以上、Ｂ：４０％以上７０％未満、Ｃ：４０％未満、の基準に従って評価した。また、各被験化合物の外用投与時の浮腫抑制率を測定して得られた測定結果を、Ａ：１００％以上、Ｂ：７０％以上１００％未満、Ｃ：７０％未満、の基準に従って評価した。結果を表７４に示す。なお、表７４には、被験化合物としてアプレミラスト又はクリサボロールを用いて得られた結果を合わせて示す。

【０６３９】

【表７４】

被検化合物	マウス慢性皮膚炎モデル(試験例8)	
	経口	外用
実施例29	A	A
実施例118	B	-
実施例119	A	-
実施例120	B	-
実施例176	B	-
実施例195	B	-
実施例199	B	-
実施例203	B	-
実施例208	B	-
実施例212	B	-
実施例234	A	-
実施例235	A	-
実施例248	A	A
実施例249	B	-
実施例251	B	A
実施例252	A	A
実施例296	A	-
アプレミラスト	B	-
クリサボロール	-	C

【０６４０】
（試験例９　ヒスタミン誘発マウス血管透過性亢進モデル）
雄性Ｃｒｌ：ＣＤ１（ＩＣＲ）マウス（６～７週齢）を用いて評価を行った。先ず、試験実施前にイソフルラン麻酔下（吸入・イソフルラン専用麻酔器で３％程度の適量）でマウス背部の毛を小型バリカンで剃った。次いで、該マウスに０．５％ｗ／ｖメチルセルロース（０．５％ＭＣ）に溶解又は懸濁させた被験化合物１０ｍｇ／ｋｇを経口投与し（１０ｍＬ／ｋｇ）、１～４時間後に０．４％エバンスブルー生理食塩水を静脈内投与（１０ｍＬ／ｋｇ）、その約２分後に背側頚部に１５ｍＭヒスタミン生理食塩水を血管透過性亢進物質として皮内投与した（２０μＬ／ｓｉｔｅ）。血管透過性非惹起群（以下、ブランク群）及び血管透過性惹起非治療群（以下、コントロール群）には０．５％ＭＣを経口投与した。また、ブランク群はヒスタミンを含まない生理食塩水を皮内投与した。次いで、３０分後に評価対象部位の組織を採取し、組織を３×３ｃｍに切りとり、１Ｍ水酸化カリウムを１ｍＬ加えて一晩３７℃に静置後、６Ｎリン酸３８０μＬ、アセトン５ｍＬ、水２．５ｍＬを加えてよく混ぜ合わせ、遠心した。遠心後の上清の吸光値（６２０／６７０ｎｍ）をプレートリーダーにて測定し、ブランク群の平均吸光値を差し引いたものを各組織溶解液の吸光値として、下記の計算式により血管透過性抑制率を算出した。
血管透過性抑制率（％）＝｛１－（各被験化合物添加時の数値－ブランク値）／（コントロール値－ブランク値）｝×１００
上記の方法により各被験化合物の血管透過性抑制率を測定して得られた測定結果を、Ａ：９０％以上、Ｂ：８０％以上９０％未満、Ｃ：８０％未満、の基準に従って評価した。被験化合物としてアプレミラストを用いた結果、評価がＣであったのに対して、被験化合物として実施例２４８で得られた化合物を用いた結果、評価はＡであった。
【０６４１】
（試験例１０　マウスＣＩＡ（関節炎）モデル）
雄性ＤＢＡ‐１ＪＮＣｒｌｊマウス（６～８週齢）を用いて評価を行った。先ず、マウス尾根部皮内にＩＩ型コラーゲン（ウシ）／ＡＣＦ乳化液を１５０μｇ／０．１ｍＬ投与し初回感作した。その２１日後に同様にＩＩ型コラーゲン（ウシ）／ＡＩＦ乳化液を尾根部皮内に１００μｇ／０．１ｍＬ投与し二次感作した。なお、ブランク群には初回感作及び二次感作時に生理食塩水を尾根部皮内投与した。次いで、二次感作日より１０日間、０．５％ｗ／ｖメチルセルロース（０．５％ＭＣ）に溶解又は懸濁させた被験化合物０．１～２０ｍｇ／ｋｇを１日１～２回経口投与した。
【０６４２】
目視及び触診にて四肢それぞれの関節炎スコアを０～４（０：症状なし、１：１本の指が赤く腫れている、２：２本以上の指又は甲が赤く腫れている、３：指，甲及び踵が赤く腫れている、４：肢全体の関節の動きが悪い）に判定し、四肢の合計を個体のスコアとして、各被験化合物を投与した固体群のスコア平均値を算出して関節炎スコアとした。また、足容積測定装置を用いて左右後肢の足容積（ｍＬ）を測定し、下記の計算式により浮腫率を算出した。
浮腫率（％）＝｛（感作後の左右加算足蹠容積－感作前の左右加算足蹠容積）/感作前の左右加算足蹠容積｝×１００
上記の方法により、ＩＩ型コラーゲン初回感作後３１日目の各被験化合物の関節炎スコアを、Ａ：２未満、Ｂ：２以上３未満、Ｃ：３以上、の基準に従って評価した。また、ＩＩ型コラーゲン初回感作後３１日目の各被験化合物の浮腫率を、Ａ：１０％未満、Ｂ：１０％以上２０％未満、Ｃ：２０％以上、の基準に従って評価した。被験化合物としてアプレミラストを用いた結果、関節炎スコア及び浮腫率の評価はいずれもＢであったのに対して、被験化合物として実施例２４８で得られた化合物を用いた結果、関節炎スコア及び浮腫率の評価はいずれもＡであった。
【０６４３】
（試験例１１　マウス遅延型過敏症（ＤＴＨ）モデル（外用））
雌性ＢＡＬＢ／ｃマウス（７～８週齢）を用いて評価を行った。先ず、マウス腹部の体

毛をバリカンで処理後、ハプテンとして３％オキサゾロン・アセトン／エタノール溶液１５０μＬを腹部に塗布した。その５日後に１％オキサゾロン・アセトン／エタノール溶液２０μＬ／耳をマウス両耳の耳介外側表面部に塗布し、炎症を惹起した。炎症惹起開始３０分後にアセトン／エタノール溶液に溶解させた１～３％の被験化合物を２０μＬ耳介に塗布した。１％オキサゾロン非塗布をブランク、１％オキサゾロンを塗布し被験化合物を用いずアセトン／エタノール溶液のみを塗布したものをコントロールとした。

【０６４４】

ダイヤルシックネスゲージにより被験化合物塗布２４時間後の耳介厚を測定し、ブランク値を差し引いた値を用いて下記の計算式により浮腫抑制率を算出した。

浮腫抑制率（％）＝｛１－（各被験化合物添加時の数値－ブランク値）／（コントロール値－ブランク値）｝×１００

上記の方法により各被験化合物の外用投与時の浮腫抑制率を測定して得られた測定結果を、Ａ：６０％以上、Ｂ：４０％以上６０％未満、Ｃ：４０％未満、の基準に従って評価した。結果を表７５に示す。なお、表７５には、被験化合物としてクリサボロールを用いて得られた結果を合わせて示す。

【０６４５】

【表７５】

被検化合物	マウスDTHモデル（試験例11）
	外用
実施例29	A
実施例248	A
実施例251	B
実施例252	B
クリサボロール	C

【０６４６】

（試験例１２　マウスブレオマイシンモデル）

雌性Ｃ５７ＢＬ／６Ｊマウス（７週齢）を用いて評価を行った。２ｍｇ/ｋｇブレオマイシン（ＢＬＭ）を麻酔下にて中咽頭投与し肺線維化を惹起した。ＢＬＭ投与６日後にＢＬＭ投与日からの体重減少率が均一になるように実験群に分割した。ＢＬＭ投与後７日目以降１４日間、０．５％ｗ／ｖメチルセルロース（０．５％ＭＣ）に溶解又は懸濁させた被験化合物を１日１回、１０～１００ｍｇ／ｋｇずつ経口投与（１０μＬ／ｇ）した。ＢＬＭ投与後２１日目に麻酔下にて採血後、肺を１０％中性緩衝ホルマリン液で固定し、組織検査のために処理した。線維化の程度の評価は、血清中サーファクタントプロテインＤ（ＳＰ－Ｄ）濃度をＥＬＩＳＡ法により測定した。さらに、肺の組織切片をＡｓｃｈｃｒｏｆｔらの評価基準を改訂した基準により採点し評価した。被験化合物として実施例２４８で得られた化合物及び特発性肺線維症治療薬であるニンテダニブを用いた結果、実施例２４８で得られた化合物は血清中ＳＰ－Ｄ濃度及び肺線維化スコアがニンテダニブと同等以下であり、血清中ＳＰ－Ｄ濃度及び肺線維化スコアをニンテダニブと同等以下に抑制できることが確認された。

【０６４７】

（試験例１３　マウス掻痒モデル）

雄性ＩＣＲマウス（５～７週齢）を用いて評価を行った。あらかじめマウス両後肢皮下に微小マグネットを埋め、マウス頚背部の毛を剃った。試験当日、被験化合物を０．５％ｗ／ｖメチルセルロース（０．５％ＭＣ）に溶解又は懸濁させて経口投与した。被験化合物投与２時間後に、生理食塩水に溶解させた３００ｎＭサブスタンスＰを、マウス頚背部に５０μＬ皮内投与した。被験化合物の代わりに０．５％ＭＣを経口投与、及びサブスタ

ンスＰの代わりに生理食塩水を皮内投与した非掻痒惹起群をブランク、被験化合物の代わりに０．５％ＭＣを経口投与した群を掻痒惹起コントロールとした。小動物用掻痒測定システム　マイクロアクトＩＩにて皮内投与直後から３０分間の掻痒行動を自動測定した。被験化合物として実施例２４８で得られた化合物及びアプレミラスト、並びに、ヒスタミンＨ１受容体アンタゴニストであるフェキソフェナジンを用いた結果、実施例２４８で得られた化合物はアプレミラストよりも低濃度でマウス掻破行動を抑制した。また、フェキソフェナジンは掻破行動を抑制しなかった。

【０６４８】

（試験例１４　ＤＳＳ誘発マウス大腸炎モデル）

雄性Ｃ５７ＢＬ／６Ｊマウス（７週齢）を用いて評価を行った。水で溶解させたデキストラン硫酸ナトリウム（ＤＳＳ）を５日間自由飲水させ、その後４～５日間、水を自由飲水させた。被験化合物は０．５％ｗ／ｖメチルセルロース（０．５％ＭＣ）に溶解又は懸濁させて初日より１日１回経口投与した。被験化合物の代わりに０．５％ＭＣを経口投与し、ＤＳＳの代わりに水を自由飲水させた炎症非惹起群をブランク、被験化合物の代わりに０．５％ＭＣを経口投与した群を炎症惹起コントロールとした。Ｄｉｓｅａｓｅ　ａｃｔｉｖｉｔｙ　ｉｎｄｅｘ（ＤＡＩ）スコアにより、大腸炎抑制作用を評価した。被験化合物として実施例２４８で得られた化合物及びアプレミラストを用いた結果、実施例２４８で得られた化合物はアプレミラストよりも低濃度でＤＡＩスコアを抑制した。

【０６４９】

表５７～表６９に示すように、実施例３、４、２５、２９、３０、３２、７５、１１８、１１９、１２０、１７６、１７７、１９５、１９８、１９９、２０３、２０８、２１２、２３４、２３５、２４８、２４９、２５１、２５２、２９６で得られた化合物は特に優れたＰＤＥ４阻害活性を有する。また、試験例３～７の結果から、これらの化合物（特に、実施例２４８で得られた化合物）は、優れたＴＮＦα阻害活性、ＩＬ－１７Ａ阻害活性、ＩＬ－２３阻害活性、ＩＬ－４阻害活性、ＩＬ－５阻害活性、ＩＬ－１３阻害活性、ＴＧＦ－β阻害活性、及び抗腫瘍活性を示すことが確認された。さらに、マウスによる生体内（ｉｎ　ｖｉｖｏ）試験によって、これらの化合物を含有する治療剤は、炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患の治療のための治療剤、特には、乾癬（関節症性乾癬、尋常性乾癬等）、アトピー性皮膚炎、アレルギー性結膜炎、喘息、ＣＯＰＤ、関節リウマチ、特発性肺線維症、潰瘍性大腸炎、非アルコール性脂肪性肝炎、筋ジストロフィー、円形脱毛症、白斑、化膿性汗腺炎、扁平苔癬、大腸がん、肺がん、血液がん、脳腫瘍の治療に有用であることが確認された。

【産業上の利用可能性】

【０６５０】

以上説明したように、本発明によれば、優れたＰＤＥ４阻害活性を有する化合物を含有し、炎症性疾患、自己免疫疾患、線維化疾患、及びがん疾患の治療に有用な治療剤を提供することが可能となる。

フロントページの続き

(51)Int.Cl. FI
Ａ６１Ｐ 37/06 (2006.01) Ａ６１Ｐ 37/06

(72)発明者 田村 圭司
東京都中央区京橋二丁目４番１６号 Ｍｅｉｊｉ Ｓｅｉｋａファルマ株式会社内
(72)発明者 山川 建
神奈川県横浜市港北区師岡町７６０ Ｍｅｉｊｉ Ｓｅｉｋａファルマ株式会社内
(72)発明者 一色 聡志
神奈川県小田原市栢山７８８ Ｍｅｉｊｉ Ｓｅｉｋａファルマ株式会社内
(72)発明者 脇山 佳也
神奈川県小田原市栢山７８８ Ｍｅｉｊｉ Ｓｅｉｋａファルマ株式会社内
(72)発明者 大内 祥平
神奈川県横浜市港北区師岡町７６０ Ｍｅｉｊｉ Ｓｅｉｋａファルマ株式会社内

審査官 高橋 樹理

(56)参考文献 特表２００３－５２２７７１（ＪＰ，Ａ）
国際公開第２０１５／００５４２９（WO，Ａ１）
国際公開第２０１８／１２４０６０（WO，Ａ１）
CLARK, R. B. et al., Discovery of Novel 2-((Pyridin-3-yloxy)methyl)piperazines as α7 Nicotinic Acetylcholine Receptor Mo, Journal of Medicinal Chemistry, ２０１４年, Vol. 57, pp. 3966-3983, ISSN 0022-2623

(58)調査した分野(Int.Cl.，ＤＢ名)
Ａ６１Ｋ ３１／４９９５
Ａ６１Ｋ ３１／５３８６
ＣＡｐｌｕｓ／ＲＥＧＩＳＴＲＹ／ＭＥＤＬＩＮＥ／ＥＭＢＡＳＥ／ＢＩＯＳＩＳ（ＳＴＮ）