(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2013 年 5 月 2 日(02.05.2013)

WIPO | PCT

(10) 国際公開番号
WO 2013/062079 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 498/04 (2006.01) *A61K 31/695* (2006.01)
A61K 31/424 (2006.01) *A61P 25/08* (2006.01)
A61K 31/427 (2006.01) *A61P 25/18* (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01) *A61P 25/20* (2006.01)
A61K 31/444 (2006.01) *A61P 25/22* (2006.01)
A61K 31/497 (2006.01) *A61P 25/24* (2006.01)
A61K 31/501 (2006.01) *A61P 25/28* (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01) *A61P 25/30* (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01) *C07F 7/10* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2012/077697

(22) 国際出願日: 2012 年 10 月 26 日(26.10.2012)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2011-237606 2011 年 10 月 28 日(28.10.2011) JP

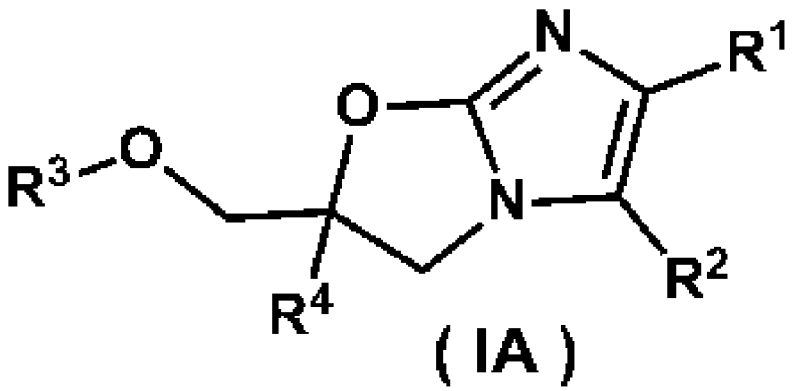
(71) 出願人: 大正製薬株式会社 (TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田３丁目２４番１号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: 浦部　洋樹 (URABE Hiroki); 〒1708633 東京都豊島区高田３丁目２４番１号　大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 下野　梨絵 (SHIMONO Rie); 〒1708633 東京都豊島区高田３丁目２４番１号　大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 民田　智子 (TAMITA Tomoko); 〒1708633 東京都豊島区高田３丁目２４番１号　大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 服部　信隆 (HATTORI Nobutaka); 〒1708633 東京都豊島区高田３丁目２４番１号　大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 坂上　一成 (SAKAGAMI Kazunari); 〒1708633 東京都豊島区高田３丁目２４番１号　大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 松田　洋平 (MATSUDA Yohei); 〒1708633 東京都豊島区高田３丁目２４番１号　大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 安原　明登 (YASUHARA Akito); 〒1708633 東京都豊島区高田３丁目２４番１号　大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 増田　誠治 (MASUDA Seiji); 〒1708633 東京都豊島区高田３丁目２４番１号　大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 小西　一豪 (KONISHI Kazuhide); 〒1708633 東京都豊島区高田３丁目２４番１号　大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 中村　年男 (NAKAMURA Toshio); 〒1708633 東京都豊島区高田３丁目２４番１号　大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 山本　修資 (YAMAMOTO Shuji); 〒1708633 東京都豊島区高田３丁目２４番１号　大正製薬株式会社内 Tokyo (JP).

[続葉有]

(54) **Title**: DIHYDROIMIDAZOOXAZOLE DERIVATIVE

(54) 発明の名称 : ジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体



(IA)

(57) **Abstract**: The present invention relates to: a dihydroimidazooxazole derivative represented by general formula (IA) or a pharmaceutically acceptable salt thereof, which has positive allosteric modulator activity on metabotropic glutamate receptor subtype 2 (mGlu2 receptor); and a pharmaceutical product for prevention or treatment of a disease selected from the group consisting of schizophrenia, Alzheimer's disease, cognitive impairment, dementia, anxiety disorders, depression, attention deficit/hyperactivity disorder (AD/HD), drug dependence, convulsions, tremor and sleep disorders, said pharmaceutical product containing the dihydroimidazooxazole derivative or a pharmaceutically acceptable salt thereof as an active ingredient. (In the formula, R^1 represents a hydrogen atom or the like; R^2 represents a hydrogen atom or the like; R^3 represents an aryl group or the like; and R^4 represents a hydrogen atom or the like.)

(57) 要約:　本発明は、代謝型グルタミン酸受容体サブタイプ２（ｍＧＩｕ２受容体）に対してポジティブアロステリックモジュレーター作用を有する、一般式（ＩＡ）で表されるジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体又はその医薬上許容される塩、並びにそれらを有効成分として含有する統合失調症、アルツハイマー病、認知機能障害、認知症、不安障害、うつ病、ＡＤ／ＨＤ（注意欠如/多動性障害）、薬物依存、痙攣、振戦及び睡眠障害からなる群から選択される疾患の予防又は治療用医薬に関する。（式中、R^1は、水素原子等、R^2は、水素原子等、R^3は、アリール等、R^4は、水素原子等を示す。）

WO 2013/062079 A1

(74) 代理人: 特許業務法人浅村特許事務所 (ASAMURA PATENT OFFICE, P.C.); 〒1408776 東京都品川区東品川２丁目２番２４号　天王洲セントラルタワー Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告（条約第 21 条(3)）

— 補正された請求の範囲（条約第 19 条(1)）

明　細　書

発明の名称 ： ジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体

技術分野

[0001] 本発明は、代謝型グルタミン酸受容体サブタイプ２（ｍＧｌｕ２受容体）に対してポジティブアロステリックモジュレーター作用を有する新規な化合物又はその医薬上許容される塩、並びにそれらを有効成分として含有する統合失調症、アルツハイマー病、認知機能障害、認知症、不安障害、うつ病、ＡＤ／ＨＤ（注意欠如/多動性障害）、薬物依存、痙攣、振戦及び睡眠障害からなる群から選択される疾患の予防又は治療用医薬に関する。

背景技術

[0002] グルタミン酸受容体は、イオンチャネル型グルタミン酸受容体及び代謝型グルタミン酸受容体（ｍＧｌｕ受容体）に大きく分類される（非特許文献１、２）。このうちｍＧｌｕ受容体はＧタンパク質と共役するＧＰＣＲ型グルタミン酸受容体として同定されたが、１９９０年代初めに相次いで受容体ｃＤＮＡがクローニングされた（非特許文献３、４）。現在、８つのサブタイプ（ｍＧｌｕ１～ｍＧｌｕ８）の存在が報告されており、これらは受容体構造、薬理学的特性及び情報伝達系の違いにより３つのグループ（グループＩ：ｍＧｌｕ１、ｍＧｌｕ５；グループＩＩ：ｍＧｌｕ２、ｍＧｌｕ３；グループＩＩＩ：ｍＧｌｕ４、ｍＧｌｕ６、ｍＧｌｕ７、ｍＧｌｕ８）に分類される（非特許文献５～７）。これらの中で、グループＩＩに属するｍＧｌｕ２及びｍＧｌｕ３受容体は、Ｇｉ／Ｇｏタンパク質と共役し、アデニル酸シクラーゼ活性を抑制的に調節しており、アゴニストによるｍＧｌｕ２及びｍＧｌｕ３受容体の活性化はフォルスコリン刺激誘発ｃＡＭＰ蓄積を抑制する（非特許文献１、８、９）。中枢神経系において、ｍＧｌｕ２及びｍＧｌｕ３受容体は、大脳皮質、嗅球、線条体、側坐核、視床、海馬、扁桃体などに多くの発現が認められている（非特許文献１０～１４）。これらの部位は情動・認知・意欲・報酬といった脳機能に関与していることから、ｍＧｌｕ２

及びｍＧＩｕ３受容体の不安障害、統合失調症、うつ病、薬物依存症といった精神疾患との関連性が示唆されている（非特許文献１５～１９）。

[0003] 受容体欠損マウスを用いた解析から、ｍＧＩｕ２／３受容体アゴニストの抗精神病様作用には主にｍＧＩｕ２受容体が関与していると考えられている（非特許文献２０～２２）。さらに内因性リガンドであるグルタミン酸の結合部位（オルソステリック結合部位）とは異なる活性調節部位（アロステリック結合部位）の存在が報告され、選択的ｍＧＩｕ２受容体ポジティブアロステリックモジュレーター（ＰＡＭ）が創出された（非特許文献２３、２４）。これら選択的ｍＧＩｕ２受容体ＰＡＭはｍＧＩｕ２／３受容体と同様に各種動物モデルにおいて抗精神病様作用や認知機能障害改善作用を示すことから、統合失調症治療薬としての可能性が示唆されている（非特許文献２５～３２）。また、ｍＧＩｕ２受容体ＰＡＭは各種動物モデルに対する抗不安作用が認められていることから、不安障害治療薬としての可能性も示唆されている（非特許文献２５、２８、３３、３４）。

[0004] 最近、ｍＧＩｕ２受容体ポジティブアロステリックモジュレーター作用を有する化合物が報告されている（非特許文献３５～３７）。しかし、これらの文献には本発明化合物のジヒドロイミダゾオキサゾール骨格をもつ化合物についてはなんら開示も示唆もない。

先行技術文献

非特許文献

[0005] 非特許文献1：Science, 258(5082), 597-603, 1992.

非特許文献2：Psychopharmacology (Berl), 179(1), 4-29, 2005.

非特許文献3：Nature, 349(6312), 760-765, 1991.

非特許文献4：Science, 252(5010), 1318-1321, 1991.

非特許文献5：Neuropharmacology, 34(1), 1-26, 1995

非特許文献6：Annu Rev Pharmacol Toxicol., 37, 205-237, 1997.

非特許文献7：Neuropharmacology, 38(10), 1431-1476, 1999.

非特許文献8：Neuron, 8(1), 169-179, 1992.

非特許文献9：J Neurosci, 13(4), 1372-1378, 1993.

非特許文献10：Neurosci Lett., 202(3), 197-200, 1996.

非特許文献11：Neuroscience, 71(4), 949-976, 1996.

非特許文献12：Neurosci Res., 30(1), 65-82, 1998.

非特許文献13：J Comp Neurol., 505(6), 682-700, 2007.

非特許文献14：Brain Res., 1197, 47-62, 2008.

非特許文献15：Current Drug Targets - CNS & Neurological Disorders, 1, 215-225, 2002.

非特許文献16：Nat. Rev. Drug Discov., 4(2), 131-144, 2005.

非特許文献17：Eur J Pharmacol., 639(1-3), 59-66, 2010.

非特許文献18：Neuropharmacology. 2011 Jun 21. [Epub ahead of print] PMID: 21704048.

非特許文献19：Neuropharmacology, 60(7-8), 1017-1041, 2011.

非特許文献20：Eur J Pharmacol., 397(1), R1-2, 2000.

非特許文献21：Psychopharmacology (Berl), 196(3), 431-440, 2008.

非特許文献22：J Pharmacol Exp. Ther., 326(1), 209-217, 2008.

非特許文献23：J Med Chem., 46(15), 3189-3192, 2003.

非特許文献24：Mol Pharmacol., 64(4), 798-810, 2003.

非特許文献25：Psychopharmacology (Berl), 179(1), 271-283, 2005.

非特許文献26：Bioorg Med Chem Lett., 15(18), 4068-4072, 2005.

非特許文献27：J Pharmacol Exp Ther., 315(3), 1181-1187, 2005.

非特許文献28：J Pharmacol Exp Ther., 318(1), 173-185, 2006.

非特許文献29：Mol Pharmacol., 72(2), 477-484, 2007.

非特許文献30：Psychopharmacology (Berl), 192(4), 511-519, 2007.

非特許文献31：Neuroscience, 168(1), 209-218, 2010.

非特許文献32：ACS Med Chem Lett., 1(8), 406-410, 2010.

非特許文献33：J Pharmacol Exp Ther., 336(1), 165-177, 2011.

非特許文献34：Neuropharmacology, 62, 322-331, 2012.

非特許文献35：Expert Opin. Ther. Patents, 19(9), 1259-1275, 2009.

非特許文献36：Current Medicinal Chemistry, 18(1), 47-68, 2011.

非特許文献37：ACS Chem. Neurosci., 2(8), 382-393, 2011.

発明の概要

発明が解決しようとする課題

[0006] 本発明の目的は、ｍＧＩｕ２受容体に対してポジティブアロステリックモジュレーター作用を有する新規な化合物を見出し、統合失調症、アルツハイマー病、認知機能障害、認知症、不安障害、うつ病、ＡＤ／ＨＤ（注意欠如/多動性障害）、薬物依存、痙攣、振戦及び睡眠障害等の予防又は治療用医薬を提供することにある。

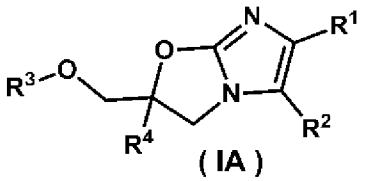
課題を解決するための手段

[0007] 本発明者らは、鋭意検討した結果、ｍＧＩｕ２受容体ポジティブアロステリックモジュレーター作用を有する新規ジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体を見出し、本発明を完成した。

すなわち本発明は、

（１）式（ＩＡ）

[化1]



(IA)

[式（ＩＡ）中、

R^1は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、ヒドロキシ、及びC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、アミノ（該アミノはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル、及びC_{1-6}アルカノイルからなる群より選ばれる１又は２

個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、アリール、ヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、又はカルボキシを示し；

R^2は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１～３個のハロゲン原子で置換されてもよい。）、イミノ、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、アリール、C_{3-8}シクロアルキル、及びカルボキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、C_{1-6}アルキルスルホニル、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又は４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、トリC_{1-6}アルキルシリル、アリールカルボニル、アリールスルホニル、C_{3-8}シクロアルキル、C_{2-6}アルケニル（該C_{2-6}アルケニルはC_{1-6}アルコキシで置換されてもよい。）、又はC_{3-8}シクロアルキルカルボニルを示し；

R^3は、アリール、ヘテロアリール、又はC_{3-8}シクロアルキル（該アリール、ヘテロアリール、及びC_{3-8}シクロアルキルは、ハロゲン原子、C_{1-8}アルキル（該C_{1-8}アルキルはシアノ、ヒドロキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル

、及びアリールからなる群より選ばれる１～５個の基で置換されてもよい。）、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、アリールオキシ、C_{1-6}アルカノイル、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ及びC_{1-6}アルカノイルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状エーテル（該４～８員の環状エーテルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、C_{5-8}ビシクロアルキル（該C_{5-8}ビシクロアルキルは１～３個のハロゲン原子で置換されてもよい。）、アダマンチル、C_{1-6}アルコキシカルボニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、及びアリールカルボニルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、キノリノニル（該キノリノニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はインダニル（該インダニルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）を示し；

R^4は、水素原子又はC_{1-6}アルキルを示す］

で表されるジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（２）上記式（ＩＡ）において、

R^4が、水素原子である（１）に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（３）上記式（ＩＡ）において、

R^1が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、ヒドロキシ、及びC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のＣ

$_{1-6}$アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリール（該ヘテロアリールはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）であり；

R^2が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、イミノ、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、アリール、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、C_{1-6}アルキルスルホニル、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又は４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、トリC_{1-6}アルキルシリル、C_{3-8}シクロアルキル又はC_{3-8}シクロアルキルカルボニルであり；

R^3が、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールは、ハロゲン原子、C_{1-8}アルキル（該C_{1-8}アルキルはシアノ、ヒドロキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びアリールからなる群より選ばれる１～５個の基で置換されてもよい。）、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、アリールオキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状エーテル（該４～８員の環状エーテルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換

されてもよい。）、C_{5-8}ビシクロアルキル（該C_{5-8}ビシクロアルキルは１～３個のハロゲン原子で置換されてもよい。）、アダマンチル、及びアリールカルボニルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、又はインダニル（該インダニルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）である（１）又は（２）に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（４）上記式（ＩＡ）において、

R^1が、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリールである（１）～（３）いずれか１つに記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（５）上記式（ＩＡ）において、

R^1が、シアノ、又はカルバモイルである（１）～（４）いずれか１つに記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（６）上記式（ＩＡ）において、

R^2が、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、C_{1-6}アルコキシ、アリール、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは１～３個のC_{1-6}アルコキシ基で置換されてもよい。）、又はC_{3-8}シクロアルキルである（１）～（５）いずれか１つに記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（７）上記式（ＩＡ）において、

R^2が、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、又はC_{3-8}シクロアルキルである（１）～（６）いずれか１つに記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

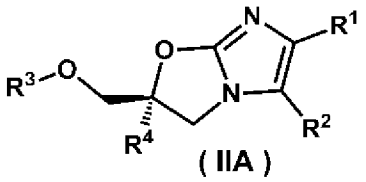
（８）上記式（ＩＡ）において、

R^3が、アリール（該アリールは、ハロゲン原子、C_{1-8}アルキル（該C_{1-8}アル

キルは１～３個のアリールで置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びアリールからなる群より選ばれる１～５個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状エーテル（該４～８員の環状エーテルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、C_{5-8}ビシクロアルキル（該C_{5-8}ビシクロアルキルは１～３個のハロゲン原子で置換されてもよい。）、アダマンチル、及びアリールカルボニルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは、ハロゲン原子、アルキル、及びアリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、又はインダニル（該インダニルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）である（１）～（７）いずれか１つに記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（９）上記式（ＩＡ）が、下記式（ＩＩＡ）

[化2]

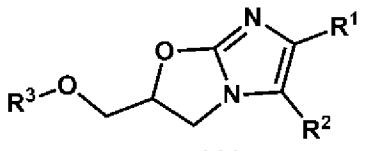


(IIA)

である（１）～（８）いずれか１つに記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（１０）式（Ｉ）

[化3]



(I)

［式（Ｉ）中、

R^1は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、ヒドロキシ、及びC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、アミノ（該アミノはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル、及びC_{1-6}アルカノイルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）を示し；

R^2は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、イミノ、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、C_{1-6}アルキルスルホニル、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又は４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はトリC_{1-6}アルキルシリルを示し；

R^3は、アリール、ヘテロアリール、又はC_{3-8}シクロアルキル（該アリール、ヘテロアリール、及びC_{3-8}シクロアルキルは、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、

ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、アリールオキシ、C_{1-6}アルカノイル、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ及びC_{1-6}アルカノイルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、及びピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、又はキノリノニル（該キノリノニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）を示す］

で表されるジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（１１）上記式（Ｉ）において、

R^1が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、ヒドロキシ、及びC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリール（該ヘテロアリールはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）であり；

R^2が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、イミノ、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}ア

ルキル、C_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、C_{1-6}アルキルスルホニル、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又は４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はトリC_{1-6}アルキルシリルであり；

R^3が、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールは、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、アリールオキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、及びピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）である（１０）に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（１２）上記式（Ｉ）において、

R^1が、ハロゲン原子、シアノ、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリールである（１０）又は（１１）に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（１３）上記式（Ｉ）において、

R^1が、シアノ、又はカルバモイルである（１０）～（１２）いずれか１つに記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（１４）上記式（Ｉ）において、

R^2が、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、C_{1-6}アルコキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、又はヘテロアリール（該ヘテロアリールは、１～３個のC_{1-6}アルコキシで置換されてもよい。）である（１０）～（１３）いずれか１つに記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（１５）上記式（Ｉ）において、

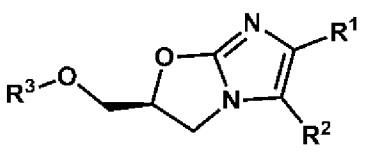
R^2が、C_{1-6}アルキル、又はハロC_{1-6}アルキルである（１０）～（１４）いずれか１つに記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（１６）上記式（Ｉ）において、

R^3が、アリール（該アリールは、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、及びヘテロアリール（該ヘテロアリールは、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）である（１０）～（１５）いずれか１つに記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（１７）上記式（Ｉ）が、下記式（ＩＩ）

[化4]



(II)

である（１０）～（１６）いずれか１つに記載のジヒドロイミダゾオキサゾ

ール誘導体、又はその医薬上許容される塩、

（１８）上記（１）～（１７）のいずれか１つに記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩を有効成分として含有する医薬組成物、

（１９）上記（１）～（１７）のいずれか１つに記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩を有効成分として含有することを特徴とする、統合失調症、アルツハイマー病、認知機能障害、認知症、不安障害、うつ病、ＡＤ／ＨＤ（注意欠如/多動性障害）、薬物依存、痙攣、振戦及び睡眠障害からなる群から選択される疾患の予防又は治療用医薬、である。

発明の効果

[0008] 本発明の新規ジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体は、ｍＧｌｕ２受容体の活性調節部位に作用して、生理的リガンド（グルタミン酸）による受容体刺激を増強させることが明らかになった。

発明を実施するための形態

[0009] 本明細書で使用される用語は、以下の意味を有する。

[0010] 「ハロゲン原子」とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、又はヨウ素原子を示す。

[0011] 「C_{1-6}アルキル」とは、直鎖状、又は分枝鎖状の炭素原子数１～６のアルキル基を示し、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソプロピル、ｎ－ブチル、イソブチル、ｓｅｃ－ブチル、ｔｅｒｔ－ブチル、ｎ－ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、ｔｅｒｔ－ペンチル、ｎ－ヘキシル等の基を挙げることができる。

「C_{1-8}アルキル」とは、直鎖状、又は分枝鎖状の炭素原子数１～８のアルキル基を示し、メチル、エチル、ｎ－プロピル、イソプロピル、ｎ－ブチル、イソブチル、ｓｅｃ－ブチル、ｔｅｒｔ－ブチル、ｎ－ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、ｔｅｒｔ－ペンチル、ｎ－ヘキシル、ｎ－ヘプチル、ｎ－オクチル、２，４，４－トリメチルペンタン－２－イル等の基を挙げる

ことができる。

[0012] 「ハロC_{1-6}アルキル」とは、前記の「C_{1-6}アルキル」に１～５個の同一又は異なる前記の「ハロゲン原子」が置換したアルキル基を示し、モノフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、２－フルオロエチル、１，１－ジフルオロエチル、２－フルオロ－２－プロピル、１，１，１－トリフルオロメチル－２－メチル－２－プロピル、３－フルオロプロピル、３，３－ジフルオロプロピル、３－クロロプロピル、４，４，４－トリフルオロブチル、３，３，４，４，４－ペンタフルオロ－２－メチルブタン－２－イル等の基を挙げることができる。

[0013] 「C_{3-8}シクロアルキル」とは、環状の炭素原子数３～８のシクロアルキル基を意味し、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル基を挙げることができる。

[0014] 「C_{1-6}アルコキシ」とは、直鎖状又は分岐鎖状の炭素原子数１～６のアルコキシ基を意味し、メトキシ、エトキシ、ｎ－プロポキシ、イソプロポキシ、ｎ－ブトキシ、イソブトキシ、ｓｅｃ－ブトキシ、ｔｅｒｔ－ブトキシ、ｎ－ペンチルオキシ、イソペンチルオキシ、ネオペンチルオキシ、ｔｅｒｔ－ペンチルオキシ、ｎ－ヘキシルオキシ等の基を挙げることができる。

[0015] 「ハロC_{1-6}アルコキシ」とは、前記の「C_{1-6}アルコキシ」に１～５個の「ハロゲン原子」が置換したアルコキシ基を示し、モノフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ等の基を挙げることができる。

[0016] 「C_{3-8}シクロアルキルオキシ」とは、前記の「C_{3-8}シクロアルキル」と酸素原子が結合した基を意味し、シクロプロピルオキシ、シクロブチルオキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシ、シクロヘプチルオキシ、シクロオクチルオキシ基を挙げることができる。

[0017] 「C_{3-8}シクロアルキルカルボニル」とは、前記の「C_{3-8}シクロアルキル」とカルボニルが結合した基を意味し、シクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル、シクロヘプチルカルボニル、シクロオクチルカルボニル基を挙げることができ

る。

[0018] 「C_{1-6}アルキルスルホニル」とは、前記の「C_{1-6}アルキル」で置換されたスルホニル基を意味し、メチルスルホニル、エチルスルホニル、ｎ－プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、ｎ－ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル、ｓｅｃ－ブチルスルホニル、ｔｅｒｔ－ブチルスルホニル、ｎ－ペンチルスルホニル、イソペンチルスルホニル、ネオペンチルスルホニル、ｔｅｒｔ－ペンチルスルホニル、ｎ－ヘキシルスルホニル等の基を挙げることができる。

[0019] 「C_{1-6}アルカノイル」とは、直鎖状又は分岐鎖状の炭素原子数１～６のアルカノイル基を意味し、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、イソバレリル、ピバロイル、ヘキサノイル等の基を挙げることができる。

[0020] 「C_{2-6}アルケニル」とは、直鎖状又は分岐鎖状の炭素原子数２～６のアルケニル基を意味し、ビニル、アリル、１－プロペニル、イソプロペニル、１－ブテニル、１－メチル－２－プロペニル、１－エチル－１－エテニル、２－メチル－２－プロペニル、３－メチル－２－ブテニル、４－ペンテニル等の基を挙げることができる。

[0021] 「アリール」とは、単環から２環式の芳香族炭素環であり、フェニル、１－ナフチル、２－ナフチル等の基を挙げることができる。

[0022] 「ヘテロアリール」とは、酸素原子、窒素原子及び硫黄原子から選ばれる少なくとも1個のヘテロ原子を有し、１ないし２環からなる炭素数２－９の芳香族基であり、フリル、ピロリル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、キノリル、インドリル、ベンゾフラニル等の基が挙げられる。

[0023] 「４～８員の環状アミノ」とは、環中に１個の窒素原子を含み、他に１つ以上の窒素原子、酸素原子若しくは硫黄原子を含んでもよい４～８員の飽和又は部分飽和複素環であり、アゼチジン－１－イル、ピロリジン－１－イル、

ピペリジン－１－イル、ピペラジン－１－イル、モルホリン－４－イル、チオモルホリン－４－イル、アゼパン－１－イル、１，４－オキサゼパン－４－イル、アゾカン－１－イル等の基を挙げることができる。

[0024] 「アリールC_{1-6}アルコキシ」とは、前記の「C_{1-6}アルコキシ」に１～３個の同一又は異なる前記の「アリール」が置換したアルコキシ基を示し、ベンジルオキシ、１－フェニルエチルオキシ、２－フェニルエチルオキシ、３－フェニルプロピルオキシ、４－フェニルブチルオキシ、５－フェニルペンチルオキシ、６－フェニルヘキシルオキシ、１－ナフチルメチルオキシ、ジフェニルメチルオキシ、トリフェニルメチルオキシ等の基を挙げることができる。

[0025] 「トリC_{1-6}アルキルシリル」とは、「シリル」に３個の同一又は異なる前記の「C_{1-6}アルキル」が置換したシリル基を示し、トリメチルシリル、トリエチルシリル、ｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル等の基を挙げることができる。

[0026] 「アリールオキシ」とは、前記の「アリール」と酸素原子が結合した基を意味し、フェノキシ、１－ナフトキシ、２－ナフトキシ等の基を挙げることができる。

[0027] 「アリールスルホニル」とは、前記の「アリール」で置換されたスルホニル基を意味し、フェニルスルホニル、１－ナフチルスルホニル、２－ナフチルスルホニル等の基を挙げることができる。

[0028] 「４～８員の環状エーテル」とは、環中に１個の酸素原子を含む４～８員の環状エーテル基であり、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル等の基を挙げることができる。

[0029] 「C_{5-8}ビシクロアルキル」とは、環状の炭素原子数５～８のビシクロアルキル基を意味し、ビシクロ［２．１．０］ペンチル、ビシクロ［３．１．０］ヘキシル、ビシクロ［４．１．０］ヘプチル、ビシクロ［２．２．１］ヘプチル、ビシクロ［５．１．０］ヘプチル基を挙げることができる。

[0030] 「C_{1-6}アルコキシカルボニル」とは、前記の「C_{1-6}アルコキシ」とカルボニルが結合した基を示し、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、ｎ－プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ｎ－ブトキシカルボニル、

イソブトキシカルボニル、ｓｅｃ－ブトキシカルボニル、ｔｅｒｔ－ブトキシカルボニル、ｎ－ペンチルオキシカルボニル、イソペンチルオキシカルボニル、ネオペンチルオキシカルボニル、ｔｅｒｔ－ペンチルオキシカルボニル、ｎ－ヘキシルオキシカルボニル等の基を挙げることができる。

[0031] 「アリールカルボニル」とは、前記の「アリール」とカルボニルが結合した基を意味し、フェニルカルボニル、１－ナフチルカルボニル、２－ナフチルカルボニル等の基を挙げることができる。

[0032] 本発明の上記式（ＩＡ）における好ましいR^1は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、ヒドロキシ、及びC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリール（該ヘテロアリールはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）であり、

より好ましいR^1は、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリールであり、

さらに好ましいR^1は、ハロゲン原子、シアノ、トリフルオロメチル、カルバモイルであり、

特に好ましいR^1は、シアノ、カルバモイルである。

[0033] 本発明の上記式（ＩＡ）における好ましいR^2は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、イミノ、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、アリール、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、C

$_{1-6}$アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、C_{1-6}アルキルスルホニル、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又は４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、トリC_{1-6}アルキルシリル、C_{3-8}シクロアルキル又はC_{3-8}シクロアルキルカルボニルであり、

より好ましいR^2は、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、C_{1-6}アルコキシ、アリール、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは１～３個のC_{1-6}アルコキシ基で置換されてもよい。）、又はC_{3-8}シクロアルキルであり、

さらに好ましいR^2は、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、又はC_{3-8}シクロアルキルである。

[0034] 本発明の上記式（ＩＡ）における好ましいR^3は、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールは、ハロゲン原子、C_{1-8}アルキル（該C_{1-8}アルキルはシアノ、ヒドロキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びアリールからなる群より選ばれる１～５個の基で置換されてもよい。）、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、アリールオキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状エーテル（該４～８員の環状エーテルは１

～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、C_{5-8}ビシクロアルキル（該C_{5-8}ビシクロアルキルは１～３個のハロゲン原子で置換されてもよい。）、アダマンチル、及びアリールカルボニルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、又はインダニル（該インダニルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）であり、

より好ましいR^3は、アリール（該アリールは、ハロゲン原子、C_{1-8}アルキル（該C_{1-8}アルキルは１～３個のアリールで置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びアリールからなる群より選ばれる１～５個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状エーテル（該４～８員の環状エーテルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、C_{5-8}ビシクロアルキル（該C_{5-8}ビシクロアルキルは１～３個のハロゲン原子で置換されてもよい。）、アダマンチル、及びアリールカルボニルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは、ハロゲン原子、アルキル、及びアリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、又はインダニル（該インダニルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）であり、

さらに好ましいR^3は、アリール（該アリールは、ハロゲン原子、C_{1-8}アルキル（該C_{1-8}アルキルは１～３個のアリールで置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～５個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、C_{5-8}ビシクロアルキル（該C_{5-8}ビシクロアルキルは１～３個のハロゲン原子で置換されてもよい。）、及びアダマンチルから

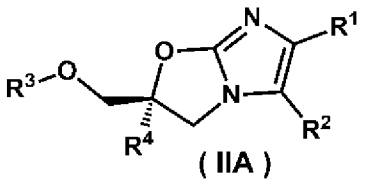
なる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）である。

[0035] 本発明の上記式（ＩＡ）における好ましいＲ^{4}は、水素原子又はメチルであり、

より好ましいＲ^{4}は、水素原子である。

[0036] 本発明の上記式（ＩＡ）における好ましい立体構造は、下記式（ＩＩＡ）であり、

[化5]



(IIA)

好ましい立体配置は（２Ｓ）体である。

[0037] 本発明の上記式（Ｉ）における好ましいＲ^{1}は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、Ｃ$_{1-6}$アルキル（該Ｃ$_{1-6}$アルキルは、ヒドロキシ、及びＣ$_{1-6}$アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロＣ$_{1-6}$アルキル、Ｃ$_{1-6}$アルカノイル、Ｃ$_{2-6}$アルケニル、Ｃ$_{1-6}$アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のＣ$_{1-6}$アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリール（該ヘテロアリールはＣ$_{1-6}$アルキル、ハロＣ$_{1-6}$アルキル、及びＣ$_{3-8}$シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）であり、

より好ましいＲ^{1}は、ハロゲン原子、シアノ、ハロＣ$_{1-6}$アルキル、Ｃ$_{1-6}$アルカノイル、Ｃ$_{1-6}$アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは２個のＣ$_{1-6}$アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリールであり、

さらに好ましいＲ^{1}は、ハロゲン原子、シアノ、トリフルオロメチル、カルバモイルであり、

特に好ましいＲ^{1}は、シアノ、又はカルバモイルである。

[0038] 本発明の上記式（Ｉ）における好ましいＲ^{2}は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、Ｃ$_{1-6}$アルキル（該Ｃ$_{1-6}$アルキルは、イミノ、ヒドロキシ、Ｃ$_{1-6}$アルコキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよ

い。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、C_{1-6}アルキルスルホニル、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又は４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はトリC_{1-6}アルキルシリルであり、

より好ましいR^2は、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、C_{1-6}アルコキシ、アリール、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは１～３個のC_{1-6}アルコキシ基で置換されてもよい。）、又はC_{3-8}シクロアルキルであり、

さらに好ましいR^2は、C_{1-6}アルキル、又はハロC_{1-6}アルキルである。

[0039] 本発明の上記式（Ｉ）における好ましいR^3は、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールは、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、アリールオキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、又はピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）であり、

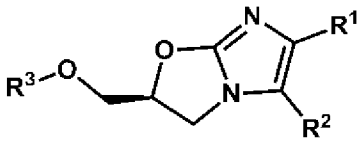
より好ましいR^3は、アリール（該アリールは、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル

、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、及びヘテロアリール（該ヘテロアリールは、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）であり、

さらに好ましいR^3は、アリール（該アリールは、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～５個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルコキシ、及びアリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）である。

[0040] 本発明の上記式（Ｉ）における好ましい立体構造は、下記式（ＩＩ）であり、

[化6]



(II)

好ましい立体配置は（２Ｓ）体である。

[0041] 本発明化合物中の好ましい化合物の例として、

(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル、

(2S)-2-{[(2'-フルオロビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

(2S)-5-エチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェ

ノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル、

(2S)-5-エチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

(2S)-5-シクロプロピル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

(2S)-5-プロピル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

(2S)-5-ブチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

5-メチル-2-({4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

2-{[3-クロロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

(2S)-5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル、

2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

(2S)-5-(2-フルオロエチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

(2S)-5-シクロプロピル-2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル、

(2S)-5-エチル-2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

(2S)-5-メチル-2-{[4-(3,3,4,4,4-ペンタフルオロ-2-メチルブタン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

(2S)-5-メチル-2-({4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル、

(2S)-5-メチル-2-{[4-(1-メチルシクロブチル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

(2S)-5-プロピル-2-({4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

(2S)-2-{[4-(7,7-ジフルオロビシクロ[4.1.0]ヘプタ-1-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

(2S)-2-{[4-(3,3-ジフルオロ-1-メチルシクロブチル)フェノキシ]メチル}-5-プロピル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド、

(2S)-2-{[4-(3,3-ジフルオロ-1-メチルシクロブチル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル

、

又はその医薬上許容される塩が挙げられる。

[0042] 「医薬上許容される塩」とは、硫酸、塩酸、臭化水素酸、リン酸、硝酸等の無機酸との塩、ギ酸、トリフルオロ酢酸、酢酸、シュウ酸、乳酸、酒石酸、フマル酸、マレイン酸、クエン酸、ベンゼンスルホン酸、メタンスルホン酸、ｐ－トルエンスルホン酸、安息香酸、カンファースルホン酸、エタンスルホン酸、グルコヘプトン酸、グルコン酸、グルタミン酸、グリコール酸、リンゴ酸、マロン酸、マンデル酸、ガラクタル酸、ナフタレン－２－スルホン酸等の有機酸との塩、リチウムイオン、ナトリウムイオン、カリウムイオン、カルシウムイオン、マグネシウムイオン、亜鉛イオン、アルミニウムイオン等の１種又は複数の金属イオンとの塩、アンモニア、アルギニン、リシン、ピペラジン、コリン、ジエチルアミン、４－フェニルシクロヘキシルアミン、２－アミノエタノール、ベンザチン等のアミンとの塩が含まれる。

[0043] なお、本発明の化合物は、各種溶媒和物としても存在し得る。また、医薬としての適用性の面から水和物の場合もある。

[0044] 本発明の化合物は、エナンチオマー、ジアステレオマー、平衡化合物、これらの任意の割合の混合物、ラセミ体等を全て含む。

[0045] 本発明の化合物は、一つ又は二つ以上の医薬的に許容される担体、賦形剤又は希釈剤と組み合せて医薬的製剤とすることができる。上記担体、賦形剤及び希釈剤として、水、乳糖、デキストロース、フラクトース、ショ糖、ソルビトール、マンニトール、ポリエチレングリコール、プロピレングリコール、デンプン、ガム、ゼラチン、アルギネート、ケイ酸カルシウム、リン酸カルシウム、セルロース、水シロップ、メチルセルロース、ポリビニルピロリドン、アルキルパラヒドロキシベンゾソルベート、タルク、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸、グリセリン、ゴマ油、オリーブ油、大豆油等の各種油等が含まれる。

[0046] また、上記の担体、賦形剤又は希釈剤に必要に応じて一般に使用される増量剤、結合剤、崩壊剤、ｐＨ調整剤、溶解剤等の添加剤が混合し、常用の製

剤技術によって錠剤、丸剤、カプセル剤、顆粒剤、粉剤、液剤、乳剤、懸濁剤、軟膏剤、注射剤、皮膚貼付剤等の経口又は非経口用医薬として調製することができる。本発明の化合物は、成人患者に対して１回の投与量として０．００１～２０００ｍｇを１日１回又は数回に分けて経口又は非経口で投与することが可能である。なお、この投与量は治療対象となる疾病の種類、患者の年齢、体重、症状等により適宜増減することが可能である。

[0047] 本発明の化合物には、一つ以上の水素原子、フッ素原子、炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子が放射性同位元素や安定同位元素と置換された化合物も含まれる。これらの標識化合物は、代謝や薬物動態研究、受容体のリガンド等として生物学的分析等に有用である。

[0048] 本発明化合物及びその医薬上許容される塩は、例えば、以下に示す方法によって合成することができるが、本発明の化合物の製造方法はこれらに限定されるものではない。

[0049] 「不活性溶媒」とは例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン、ピリジン等の芳香族系溶媒；ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素系溶媒；ジクロロメタン、クロロホルム、１，２－ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素系溶媒；テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、１，２－ジメトキシエタン、１，４－ジオキサン等のエーテル系溶媒；酢酸エチル、ギ酸エチル等のエステル系溶媒；メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール、ｔｅｒｔ－ブチルアルコール、エチレングリコール等のアルコール系溶媒；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン系溶媒；Ｎ、Ｎ－ジメチルホルムアミド、Ｎ－メチルピロリドン、Ｎ、Ｎ－ジメチルアセトアミド等のアミド系溶媒；ジメチルスルホキシド等のスルホキシド系溶媒；アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル系溶媒及び水であり、並びにこれらの均一系及び不均一系混合溶媒等である。これらの不活性溶媒は当業者に公知である種々の反応条件に応じて適宜選択される。

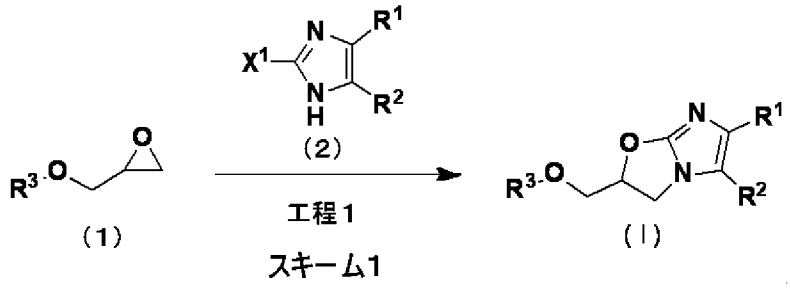
[0050] 「塩基」とは例えば、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウム等のアルカリ金属又はアルカリ土類金属の水素化物；

リチウムアミド、ナトリウムアミド、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムジシクロヘキシルアミド、リチウムヘキサメチルジシラジド、ナトリウムヘキサメチルジシラジド、カリウムヘキサメチルジシラジド等のアルカリ金属又はアルカリ土類金属のアミド；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム　ｔｅｒｔ－ブトキシド等のアルカリ金属又はアルカリ土類金属の低級アルコキシド；ブチルリチウム、ｓｅｃ－ブチルリチウム、ｔｅｒｔ－ブチルリチウム、メチルリチウム等のアルキルリチウム；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化リチウム、水酸化バリウム等のアルカリ金属又はアルカリ土類金属の水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム等のアルカリ金属又はアルカリ土類金属の炭酸塩；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等のアルカリ金属又はアルカリ土類金属の炭酸水素塩；トリエチルアミン、Ｎ－メチルモルホリン、Ｎ，Ｎ－ジイソプロピルエチルアミン、１，８－ジアザビシクロ［５．４．０］ウンデカ－７－エン（ＤＢＵ）、１，５－ジアザビシクロ［４．３．０］ノン－５－エン（ＤＢＮ）、Ｎ，Ｎ－ジメチルアニリン等のアミン；フッ化テトラ-n-ブチルアンモニウム、ベンジルトリメチルアンモニウムヒドロキシド等の４級アンモニウム塩；ピリジン、イミダゾール、２，６－ルチジン等の塩基性複素環化合物等である。これらの塩基は当業者に公知である種々の反応条件に応じて適宜選択される。

「酸」とは例えば、塩酸、臭化水素酸、硫酸、硝酸、リン酸等の無機酸、10-カンファースルホン酸、ｐ－トルエンスルホン酸、メタンスルホン酸、トリフルオロ酢酸、ギ酸、酢酸等の有機酸、塩化亜鉛（II）、塩化アルミニウム（III）、塩化チタン（IV）、三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体、三臭化ホウ素、トリメチルシリルヨージド、トリフルオロメタンスルホン酸トリメチルシリル等のルイス酸である。これらの酸は当業者に公知である種々の反応条件に応じて適宜選択される。

[0051] 式（Ｉ）で示される本発明化合物は下記スキーム１の方法にて製造することができる。

[0052] [化7]



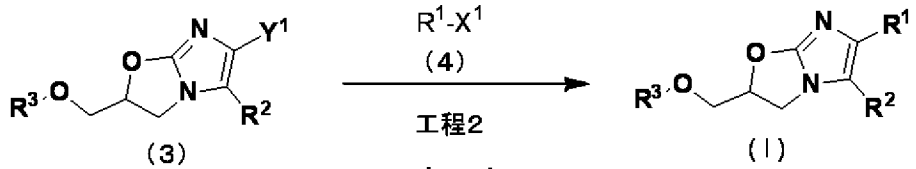
スキーム1

[0053] 式中、R^1、R^2、R^3は前記と同義である。X^1は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は有機スルホニルオキシ基（メタンスルホニルオキシ基、ベンゼンスルホニルオキシ基、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等）等の脱離基を示す。

工程１：式（Ｉ）で示される本発明化合物は不活性溶媒中、塩基存在下、式（１）で表わされる化合物と式（２）で表わされる化合物の反応により製造することができる。ここで、式（１）及び式（２）で表わされる化合物は、市販化合物、公知化合物或いは当業者に公知である種々の有機合成手法を用いて市販化合物又は公知化合物より合成した化合物を用いることができる。

[0054] 式（Ｉ）で示される本発明化合物は下記スキーム２の方法にても製造することができる。

[0055] [化8]



スキーム2

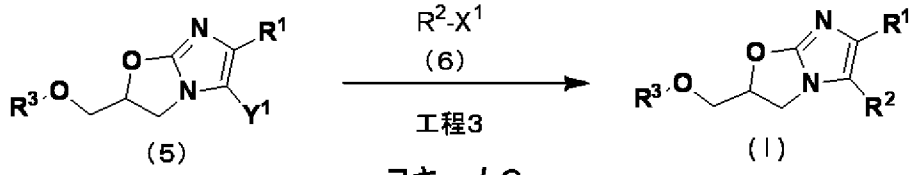
式中、R^1、R^2、R^3、X^1は前記と同義である。Y^1は水素原子又はハロゲン原子等を示す。

工程２：式（Ｉ）で示される本発明化合物は不活性溶媒中、アルキルリチウム存在下、式（３）で表わされる化合物と式（４）で表わされる化合物の反応により製造することができる。ここで、式（３）及び式（４）で表わさ

れる化合物は、市販化合物、公知化合物或いは当業者に公知である種々の有機合成手法を用いて市販化合物又は公知化合物より合成した化合物を用いることができる。

[0056] 式（Ｉ）で示される本発明化合物は下記スキーム３の方法にても製造することができる。

[0057] [化9]



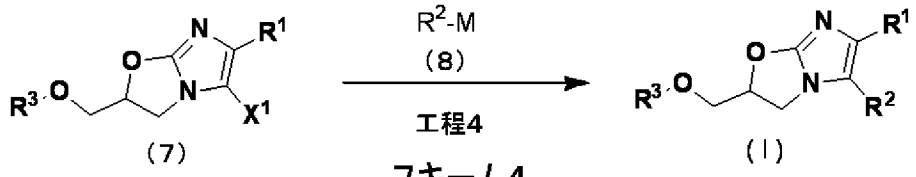
スキーム3

式中、R^1、R^2、R^3、X^1、Y^1は前記と同義である。

[0058] 工程３：式（Ｉ）で示される本発明化合物はスキーム２中の工程２と同様の方法により、式（５）で表わされる化合物と式（６）で表わされる化合物から製造することができる。 ここで、式（５）及び式（６）で表わされる化合物は、市販化合物、公知化合物或いは当業者に公知である種々の有機合成手法を用いて市販化合物又は公知化合物より合成した化合物を用いることができる。

[0059] 式（Ｉ）で示される本発明化合物は下記スキーム４の方法にても製造することができる。

[0060] [化10]



スキーム4

式中、R^1、R^2、R^3、X^1は前記と同義である。Ｍはカップリング反応で用いられる金属原子又は金属原子団を示し、式（８）で表わされる化合物の例としてマグネシウム反応剤、亜鉛反応剤、ホウ酸又はホウ酸エステルが結合したホウ素反応剤、スズ反応剤等が挙げられる。

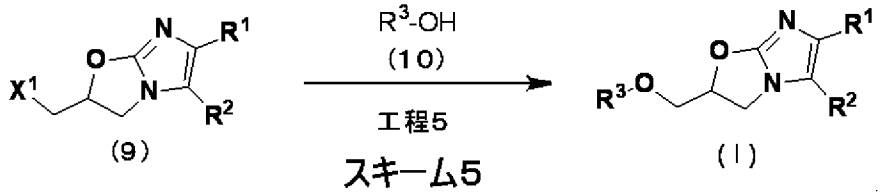
工程４：式（Ｉ）で示される本発明化合物は不活性溶媒中、塩基存在下又

は非存在下、パラジウム触媒及び必要に応じて配位子を用いて、式（７）で表わされる化合物と式（８）で表わされる化合物のカップリング反応により製造することができる。ここでカップリング反応としては、当業者に公知なカップリング反応の条件が挙げられ、例えば、｛コンプリヘンシブ　オーガニック　トランスフォーメーションズ　セカンド　エディション　{Comprehensive Organic Transformations Second Edition)　１９９９年、ジョンウィリー　アンド　サンズ（John Wiley & Sons, INC.）｝等に記載の方法、それに準じた方法、又はこれらと常法とを組み合わせることにより実施することができる。ここで、パラジウム触媒とは、例えば酢酸パラジウム（II）、塩化パラジウム（II）、ビス（トリフェニルホスフィン）酢酸パラジウム（II）、ビス（トリフェニルホスフィン）塩化パラジウム（II）、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム（０）、ビス(ジベンジリデンアセトン)パラジウム（０）、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム（０）、塩化〔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）、塩化アリルパラジウム（II）、ビス（アセトニトリル）塩化パラジウム（II）、（１，３－ビス（２，６－ジイソプロピルフェニル）イミダゾリデン）（３－クロロピリジル）塩化パラジウム（II）等を挙げることができ、配位子とは例えばトリフェニルホスフィン、２，２－ビス（ジフェニルホスフィノ）－１，１－ビナフチル（ＢＩＮＡＰ）、２－（ジ－ｔｅｒｔ－ブチルホスフィノ）ビフェニル、９，９－ジメチル－４，５－ビス（ジフェニルホスフィノ）キサンテン（Ｘａｎｔｐｈｏｓ）等を挙げることができる。ここで、式（７）及び式（８）で表わされる化合物は、市販化合物、公知化合物或いは当業者に公知である種々の有機合成手法を用いて市販化合物又は公知化合物より合成した化合物を用いることができる。

[0061] 式（Ｉ）で示される本発明化合物は下記スキーム５の方法にても製造することができる。

[0062]

[化11]



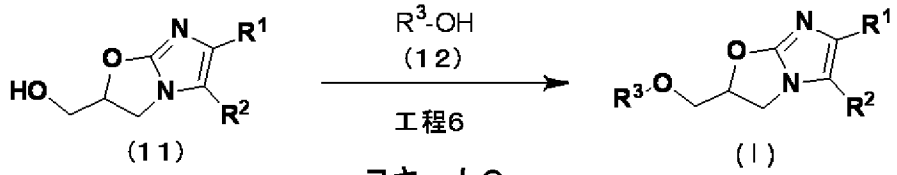
スキーム5

[0063] 式中、R^1、R^2、R^3、X^1は前記と同義である。

[0064] 工程５：式（Ｉ）で示される本発明化合物は不活性溶媒中、塩基存在下、式（９）で表わされる化合物と式（１０）で表わされる化合物の反応により製造することができる。ここで、式（９）及び式（１０）で表わされる化合物は、市販化合物、公知化合物或いは当業者に公知である種々の有機合成手法を用いて市販化合物又は公知化合物より合成した化合物を用いることができる。

[0065] 式（Ｉ）で示される本発明化合物は下記スキーム６の方法にても製造することができる。

[0066] [化12]



スキーム6

[0067] 式中、R^1、R^2、R^3は前記と同義である。

[0068] 工程６：式（Ｉ）で示される本発明化合物は、式（１１）で表わされる化合物と式（１２）で表わされる化合物の光延反応により製造することができる。光延反応とは、例えば、トリフェニルホスフィン、トリブチルホスフィン等の有機リン化合物とアゾジカルボン酸ジエチル、アゾジカルボン酸ジイソプロピル、アゾジカルボン酸ジーｔｅｒｔ－ブチル等のアゾ化合物を用いる方法、又はシアノメチルトリブチルホスホラン等のリンイリド試薬を用いる方法が挙げられる（Ｃｈｅｍ．　Ｒｅｖ．　２００９．　１０９，２５５１－２６５１参照）。 ここで、式（１１）及び式（１２）で表わされる化合物は、市販化合物、公知化合物或いは当業者に公知である種々の有機合成手

法を用いて市販化合物又は公知化合物より合成した化合物を用いることができる。

式（Ｉ）で示される本発明化合物のうち下記式（Ｉ－ＩＩ）で示される化合物は下記スキーム７の方法にて製造することができる。

[0069] [化13]



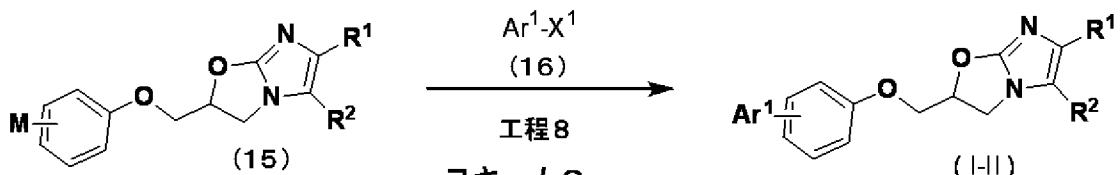
スキーム7

[0070] 式中、R^1、R^2、R^3、X^1、Ｍは前記と同義である。Ａｒ^{1}はアリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ及びC_{1-6}アルカノイルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、又はヘテロアリール（該ヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）を示す。

工程７：式（Ｉ－ＩＩ）で示される化合物はスキーム４中の工程４と同様の方法により、式（１３）で表わされる化合物と式（１４）で表わされる化合物から製造することができる。 ここで、式（１３）及び式（１４）で表わされる化合物は、市販化合物、公知化合物或いは当業者に公知である種々の有機合成手法を用いて市販化合物又は公知化合物より合成した化合物を用いることができる。

式（Ｉ）で示される本発明化合物のうち下記式（Ｉ－ＩＩ）で示される化合物は下記スキーム８の方法にても製造することができる。

[0071] [化14]



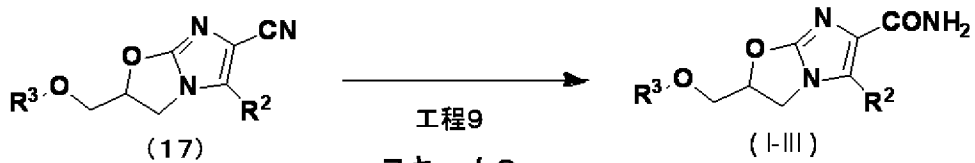
スキーム8

[0072] 式中、R^1、R^2、R^3、X^1、M、Ar^1は前記と同義である。

工程８：式（Ｉ－ＩＩ）で示される化合物はスキーム４中の工程４と同様の方法により、式（１５）で表わされる化合物と式（１６）で表わされる化合物から製造することができる。 ここで、式（１５）及び式（１６）で表わされる化合物は、市販化合物、公知化合物或いは当業者に公知である種々の有機合成手法を用いて市販化合物又は公知化合物より合成した化合物を用いることができる。

式（Ｉ）で示される本発明化合物のうち下記式（Ｉ－ＩＩＩ）で示される化合物は下記スキーム９の方法にて製造することができる。

[0073] [化15]



スキーム9

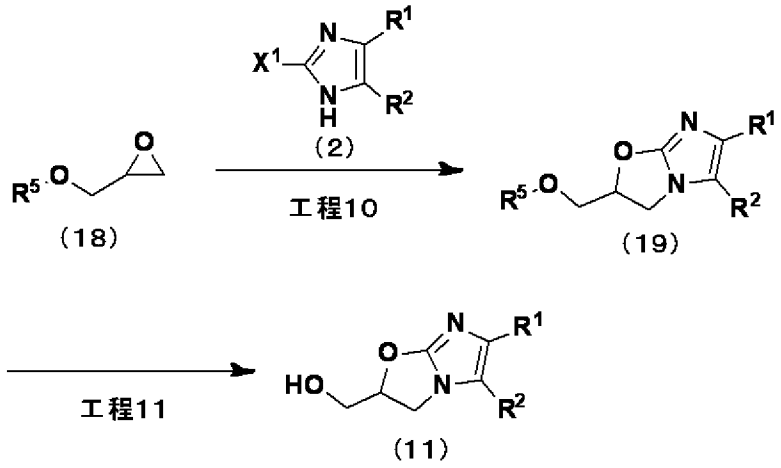
[0074] 式中、R^2、R^3は前記と同義である。

工程９：式（Ｉ－ＩＩＩ）で示される化合物は不活性溶媒中、塩基存在下、式（１７）で表わされる化合物の加水分解反応により製造することができる。 ここで、式（１７）で表わされる化合物は、市販化合物、公知化合物或いは当業者に公知である種々の有機合成手法を用いて市販化合物又は公知化合物より合成した化合物を用いることができる。

式（１１）で示される化合物は下記スキーム１０の方法にて製造することができる。

[0075]

[化16]



スキーム10

[0076] 式中、R^1、R^2、X^1は前記と同義であり、R^5はtert-ブチルジメチルシリル基、ｐ－メトキシベンジル基、２－テトラヒドロピラニル基、またトリチル基などの水酸基の保護基（Ｔｈｅｏｄｏｒａ Ｗ．Ｇｒｅｅｎ，Ｐｅｔｅｒ Ｇ．Ｍ．Ｗｕｔｓ、「有機合成における保護基（Ｇｒｅｅｎ’ｓ Ｐｒｏｔｅｃｔｉｖｅ Ｇｒｏｕｐｓ ｉｎ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ，Ｆｏｒｔｈ Ｅｄｉｔｉｏｎ）」；Ｗｉｌｅｙ Ｉｎｔｅｒｓｃｉｅｎｃｅ参照）を示す。

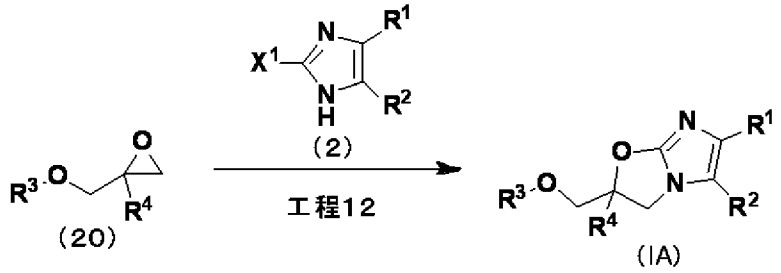
工程１０：式（１９）で示される化合物はスキーム１中の工程１と同様の方法により、式（１８）で表される化合物と式（２）で表される化合物から製造することができる。ここで、式（１８）で表される化合物は、市販化合物、公知化合物或いは当業者に公知である種々の有機合成手法を用いて合成した化合物を用いることができる。

工程１１：式（１１）で示される化合物は、Ｔｈｅｏｄｏｒａ Ｗ．Ｇｒｅｅｎ，Ｐｅｔｅｒ Ｇ．Ｍ．Ｗｕｔｓ、「有機合成における保護基（Ｇｒｅｅｎ’ｓ Ｐｒｏｔｅｃｔｉｖｅ Ｇｒｏｕｐｓ ｉｎ Ｏｒｇａｎｉｃ Ｓｙｎｔｈｅｓｉｓ，Ｆｏｒｔｈ Ｅｄｉｔｉｏｎ）」に記載されている脱保護反応により式（１９）で表される化合物から製造することができる。

式（ＩＡ）で示される本発明化合物は下記スキーム１１の方法にて製造する

ことができる。

[0077] [化17]



スキーム11

[0078] 式中、R^1、R^2、R^3、R^4、X^1は前記と同義である。

工程１２：式（Ｉ－Ａ）で示される本発明化合物はスキーム１中の工程１と同様の方法により、式（２０）で表される化合物と式（２）で表される化合物から製造することができる。ここで、式（２０）で表される化合物は、市販化合物、公知化合物或いは当業者に公知である種々の有機合成手法を用いて合成した化合物を用いることができる。

実施例

[0079] 以下、製造例、実施例及び試験例を挙げて本発明を更に詳細に説明するが、これらは本発明を限定するものではなく、また本発明の範囲を逸脱しない範囲で変化させてもよい。

製造例、実施例において、カラムクロマトグラフィーを使用して精製した際の「ＳＮＡＰ Ｃａｒｔｒｉｄｇｅ ＫＰ－ＮＨ」とはＢｉｏｔａｇｅ社ＳＮＡＰ Ｃａｒｔｒｉｄｇｅ ＫＰ－ＮＨ、「ＳＮＡＰ Ｃａｒｔｒｉｄｇｅ ＨＰ－Ｓｉｌ」とはＢｉｏｔａｇｅ社ＳＮＡＰ Ｃａｒｔｒｉｄｇｅ ＨＰ－Ｓｉｌ、「Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ ＮＨ」とはＧｒａｃｅ社のＲｅｖｅｌｅｒｉｓ（商標登録）Ａｍｉｎｏ Ｓｉｌｉｃａ Ｃａｒｔｒｉｄｇｅ、「Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ」とはＧｒａｃｅ社のＲｅｖｅｌｅｒｉｓ（商標登録）Ｓｉｌｉｃａ Ｃａｒｔｒｉｄｇｅ、「ＹＭＣ－ＤｉｓｐｏＰａｋＡＴ ＮＨ２」とはＹＭＣ社のＹＭＣ－ＤｉｓｏｐｏＰａｋＡＴ ＮＨ２である。分取薄層クロマトグラフィー（ＰＴＬＣ）を使用して精製した際にはメルク

社シリカゲル６０F_{254}、２０ｃｍ×２０ｃｍを使用した。分取薄層クロマトグラフィー（ＰＴＬＣ）ＮＨを使用して精製した際には和光純薬工業社製ＮＨ$_2$シリカゲル６０F_{254}、２０ｃｍ×２０ｃｍを使用した。

以下の製造例および実施例において使用したマイクロウェーブ反応装置はＩｎｉｔｉａｔｏｒ（Ｂｉｏｔａｇｅ　ＡＢ）又はＥｍｒｙｓ　Ｏｐｔｉｍｉｚｅｒ（ｐｅｒｓｏｎａｌ　ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ）である。

製造例及び実施例中記載の各機器データは以下の測定機器で測定した。

[0080] ＭＳスペクトル：ＬＣＭＳ－２０１０ＥＶ（島津製作所）、ＬＣＭＳ－ＩＴ－ＴＯＦ（島津製作所）、ｍｉｃｒｏｍａｓｓ　Ｐｌａｔｆｏｒｍ　ＬＣ又はｍｉｃｒｏｍａｓｓ　ＧＣＴ、Ａｇｉｌｅｎｔ　２９００及びＡｇｉｌｅｎｔ　６１５０

ＮＭＲスペクトル：日本電子社ＪＮＭ－ＥＣＡ６００（６００ＭＨｚ）、日本電子社ＪＮＭ－ＥＣＡ５００（５００ＭＨｚ）、Ｖａｒｉａｎ社ＵＮＩＴＹＮＯＶＡ３００（３００ＭＨｚ）、Ｖａｒｉａｎ社ＧＥＭＩＮＩ２０００／２００（２００ＭＨｚ）

製造例及び実施例中の化合物名はＡＣＤ／Ｎａｍｅ（ＡＣＤ／Ｌａｂｓ　１２．０，　Ａｄｖａｎｃｅｄ　Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ　Ｄｅｖｅｌｏｐｍｅｎｔ　Ｉｎｃ．）により命名した。

[0081] 実施例中で使用した略語を以下に示す。

MS（質量分析）、ESI（エレクトロスプレーイオン化）、APCI（大気圧化学イオン化）、NMR（核磁気共鳴分光法）、H（プロトン）、J（カップリング定数）、DMSO-d6（重水素化ジメチルスルホキシド）、br．s（ブロードシングレット）、s（シングレット）、d（ダブレット）、t（トリプレット）、q（カルテット）、dd（ダブルダブレット）、ddd（ダブルダブルダブレット）、dt（ダブルトリプレット）、td（トリプルダブレット）、m（マルチプレット）、v/v（容量／容量）、 v/v/v（容量／容量／容量）。

[0082] 以下の製造例及び実施例において、分取高速液体クロマトグラフィー（ＨＰＬＣ）による精製は以下の条件により行った。ただし、塩基性官能基を有

する化合物の場合、本操作でトリフルオロ酢酸を用いたときには、フリー体を得るための中和操作等を行う場合がある。

機械：Ｇｉｌｓｏｎ社　ｐｒｅｐａｒａｔｉｖｅ　ＨＰＬＣ　ｓｙｓｔｅｍ

カラム：Ｗａｔｅｒｓ　Ｓｕｎｆｉｒｅ（登録商標）　ｐｒｅｐ　Ｃ１８　ＯＢＤ，５．０μｍ，φ３０×５０ｍｍ

溶媒：Ａ液；０．１％トリフルオロ酢酸含有水、Ｂ液；０．１％トリフルオロ酢酸含有アセトニトリル

流速：４０ｍＬ／ｍｉｎ、検出法：ＵＶ　２５４ｎｍ

条件Ａ

グラジエント：０分（Ａ液／Ｂ液＝９０／１０）、１１分（Ａ液／Ｂ液＝２０／８０）、１２－１３．５分（Ａ液／Ｂ液＝５／９５）

条件Ｂ

グラジエント：０分（Ａ液／Ｂ液＝８０／２０）、１０分（Ａ液／Ｂ液＝５／９５）、１１－１３．５分（Ａ液／Ｂ液＝１／９９）

以下の実施例４２～４７および実施例６２においてラセミ体の分析は以下の条件を用いて実施した。

測定機械：Ａｇｉｌｅｎｔ社Ａｇｉｌｅｎｔ１１００

カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＡＤ－３（ダイセル、４．６ｍｍ×１５０ｍｍ）

流速：１．０ｍＬ／ｍｉｎ

移動相：エタノールのみ

[0083] 以下の製造例及び実施例において塩基性官能基を有する化合物の場合、当業者に公知である種々の反応条件により各種酸を用いて塩とする場合がある。

[0084] 製造例１：5,6-ジブロモ-2-{[(4-メトキシベンジル)オキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（中間体１）の合成

[0085] (2S)-2-{[(4-メトキシベンジル)オキシ]メチル}オキシラン（10.9 g）、2,4,5-トリブロモ-1H-イミダゾール（14.3 g）及び炭酸セシウム（18.4 g）のジメチルスルホキシド（300 mL）懸濁液を130 ℃で4時間撹拌した。反応混合物

を室温まで放冷し、水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 90/10～50/50; v/v）で精製し、表題化合物（中間体１：4.73 g，淡黄色油状物）を得た。

[0086] 製造例２：6-ブロモ-2-{[(4-メトキシベンジル)オキシ]メチル}-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（中間体７）の合成

[0087] 製造例１で得られた5,6-ジブロモ-2-{[(4-メトキシベンジル)オキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（中間体１：1.0 g）、3-ピリジルボロン酸（323 mg）、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(0)（276 mg）及び炭酸セシウム（2.34 g）のトルエン/エタノール/水（3/3/2; v/v/v, 10 mL）懸濁液を、100 ℃で1時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷し、水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 15/85 から クロロホルム/メタノール = 97/3; v/v）で精製することで黄色アモルファスを得た。得られた黄色アモルファスをカラムクロマトグラフィー（Reveleris NH、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 80/20～30/70; v/v）で精製し、表題化合物（中間体７：672 mg，無色アモルファス）を得た。

[0088] 製造例３：2-{[(4-メトキシベンジル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（中間体８）の合成

[0089] 製造例１と同様の手法を用いて得られた6-ブロモ-2-{[(4-メトキシベンジル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（中間体２：500 mg）、亜鉛（22 mg）、シアン化亜鉛（333 mg）、1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン（314 mg）及びトリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)（259 mg）のジメチルアセトアミド（20 mL）懸濁

液を窒素雰囲気下、100 ℃で23時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷し、水及び酢酸エチルを加えセライト（登録商標）濾過し、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで1回抽出し、有機層をあわせ、水及び飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 80/20～20/80; v/v）で精製し、表題化合物（中間体８：124 mg，褐色油状物）を得た。

[0090] 製造例４：[6-ブロモ-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メタノール（中間体９）の合成

[0091] 製造例２で得られた6-ブロモ-2-{[(4-メトキシベンジル)オキシ]メチル}-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（中間体７：54 mg）にトリフルオロ酢酸（0.5 mL）を加え、室温で50分間撹拌した。反応混合物に氷冷下飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、水及びクロロホルム/メタノール（9/1; v/v）を加えて、有機層と水層を分離した。水層をクロロホルム/メタノール（9/1; v/v）で2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：クロロホルム/メタノール = 97/3～87/13; v/v）で精製し、表題化合物（中間体９：26 mg，無色固体）を得た。

[0092] 製造例５：[5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メタノール（中間体１１）の合成

[0093] 製造例４で得られた[6-ブロモ-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メタノール（中間体９：22 mg）のメタノール（2 mL）溶液に10% パラジウム炭素（22 mg）を加え、水素雰囲気下、室温で50分間撹拌した。反応混合物をセライト（登録商標）濾過し、濾液を減圧下濃縮することで、表題化合物（中間体１１：28 mg，無色固体）を得た。

[0094] 製造例６：4-メチルベンゼンスルホン酸 [5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル（中間体１２）の合成

[0095] 製造例５で得られた[5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,

3]オキサゾール-2-イル]メタノール（中間体１１：200 mg）のクロロホルム（10 mL）懸濁液に0 ℃でトリエチルアミン（0.256 mL）、トリメチルアミン塩酸塩（44 mg）、ｐ－トルエンスルホニルクロリド（263 mg）を加え、同温で5分間撹拌した後、室温まで昇温させながら1.5時間撹拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えた後、酢酸エチルを加え、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（SNAP Cartridge HP-Sil、移動相：クロロホルム/メタノール = 97/3～95/5; v/v）で精製し、表題化合物（中間体１２：229 mg, 淡黄色固体）を得た。

[0096] 製造例７：4-メチルベンゼンスルホン酸［6-シアノ-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル（中間体１３）の合成

[0097] 製造例４と同様の手法を用いて得られた2-(ヒドロキシメチル)-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（中間体１０：108 mg）のクロロホルム（5 mL）懸濁液に0 ℃でトリエチルアミン（0.168 mL）、トリメチルアミン塩酸塩（29 mg）、ｐ－トルエンスルホニルクロリド（172 mg）を加え、同温で5分間撹拌した後、室温まで昇温させながら2.5時間撹拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えた後、酢酸エチルを加え、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：クロロホルム/メタノール = 97/3～95/5; v/v）で精製し、表題化合物（中間体１３：209 mg, 無色固体）を得た。

[0098] 製造例８：4-メチルベンゼンスルホン酸（6-カルバモイル-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル)メチル（中間体１４）の合成

[0099] 製造例７で得られた4-メチルベンゼンスルホン酸（6-シアノ-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル)メチル（中間体１３：１．０ｇ）のジメチルスルホキシド（１５ｍＬ）溶液を氷冷し、炭酸カリウ

ム（８２９ｍｇ）および過酸化水素水（約３５％、２．９ｍＬ）を加えた。４０℃で１時間撹拌した後、氷水を加え、析出した固体をろ取後、水およびジエチルエーテルで洗浄した。固体を減圧下乾燥し、表題化合物（中間体１４：７４７ｍｇ）を得た。

[0100] 製造例９：2-{[(5-ブロモピリジン-2-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（中間体１５）の合成

[0101] 製造例４と同様の方法で得られた2-(ヒドロキシメチル)-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（中間体１０：２００ｍｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（５．５ｍＬ）溶液に５－ブロモ－２－フルオロピリジン（２５５ｍｇ）を加え、氷冷下水素化ナトリウム（約６０％、５８ｍｇ）を加えた。同温にて１５分間撹拌した後、室温で３０分間撹拌した。飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：クロロホルム／メタノール＝１００／０～９０／１０；ｖ／ｖ）にて精製し、表題化合物（中間体１５：２８４ｍｇ）を得た。

[0102] 製造例１０：2,5-ジブロモ-1H-イミダゾール-4-カルボニトリル（中間体１６）の合成

[0103] 1H-イミダゾール-4-カルボニトリル（３９．５ｇ）を０．４Ｍ水酸化ナトリウム水溶液（７９０ｍＬ）に溶解し、氷冷した。臭素（５３ｍＬ）を滴下し、室温で４６時間撹拌した。再度氷冷した後、固体をろ取した。氷水で洗浄した後、乾燥し、表題化合物（中間体１６：１０７．１９ｇ）を得た。

[0104] 製造例１１：4-メチルベンゼンスルホン酸 [(2S)-6-カルバモイル-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル（中間体１８）の合成

[0105] （ａ）tert-ブチル(ジメチル)[(2S)-オキシラン-2-イルメトキシ]シラン（７．５ｇ）のエタノール（１００ｍＬ）溶液に酢酸ナトリウム（６．５ｇ）

および2,5-ジブロモ-1H-イミダゾール-4-カルボニトリル（中間体１６：１２．０ｇ）を加え、６０℃で２日間撹拌した。減圧下溶媒を留去し、残渣をクロロホルム（１００ｍＬ）に懸濁させ、不溶物をろ去した。ろ液に水を加え、クロロホルムで抽出した。合わせた有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下溶媒を留去した。残渣をＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１００ｍＬ）に溶解し、氷冷した後、水素化ナトリウム（約６０％、２．１ｇ）を加えた。室温で２時間撹拌した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて反応を停止させた。水を加え、酢酸エチル／トルエン（＝５：１）にて抽出した後、有機層を水および飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下溶媒を留去し、残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝８０／２０～６０／４０）にて精製し、(2S)-5-ブロモ-2-({[tert-ブチル(ジメチル)シリル]オキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（５．４９ｇ）を得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.04 (s, 3 H), 0.08 (s, 3 H), 0.82 (s, 9 H), 3.83 (dd, J=12.0, 2.9 Hz, 1 H), 4.02 - 4.08 (m, 1 H), 4.13 - 4.22 (m, 2 H), 5.31 - 5.41 (m, 1 H)

（ｂ）(2S)-5-ブロモ-2-({[tert-ブチル(ジメチル)シリル]オキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（５．４８ｇ）のテトラヒドロフラン（５１ｍＬ）溶液を－７８℃に冷却し、ｎ－ブチルリチウム（２．６４Ｍヘキサン溶液、７．０ｍＬ）を加えた。同温にて１時間撹拌した後、ヨウ化メチル（１．９ｍＬ）を滴下し、同温にて１時間、０℃にて３０分間撹拌した。飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて反応を停止させた後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー（ＳＮＡＰ　Ｃａｒｔｒｉｄｇｅ　ＫＰ－ＮＨ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝６０／４０）にて精製し、(2S)-2-({[tert-ブチル(ジメチル)シリル]オキシ}メチル)-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ

[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（３．０ｇ）を得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.04 (s, 3 H), 0.08 (s, 3 H), 0.82 (s, 9 H), 2.31 (s, 3 H), 3.84 (dd, J=11.8, 3.1 Hz, 1 H), 3.96 - 4.03 (m, 1 H), 4.05 - 4.15 (m, 2 H), 5.24 - 5.34 (m, 1 H)

（ｃ）(2S)-2-({[tert-ブチル(ジメチル)シリル]オキシ}メチル)-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（３．０ｇ）のクロロホルム／メタノール（１：１、１００ｍＬ）溶液に(+/-)-カンファー-10-スルホン酸（１．２ｇ）を加え、室温で一晩撹拌した。氷冷した後、トリエチルアミン（３．６ｍＬ）のクロロホルム（３０ｍＬ）溶液を加え、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー（ＹＭＣ－ＤｉｓｐｏＰａｋＡＴ　ＮＨ２、移動相：クロロホルム／メタノール＝１００／０～９０／１０）にて精製した。得られた固体をヘキサン／酢酸エチル（＝１／２）中で撹拌洗浄し、固体をろ取、乾燥し、(2S)-2-(ヒドロキシメチル)-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（１．０６ｇ）を得た。本項化合物を下記条件によるHPLC分析にて光学純度を測定したところ、99%ee以上であった。

ＨＰＬＣ分析

カラム：ＣＨＩＲＡＬＰＡＫ　ＡＤ－３（ダイセル、４．６ｍｍ×１５０ｍｍ）

流速：１ｍＬ／ｍｉｎ

移動相：ヘキサン／エタノール＝５０／５０

本項化合物の保持時間：２．２ｍｉｎ（ラセミ体の保持時間：２．０ｍｉｎ及び２．２ｍｉｎ）

（ｄ）(2S)-2-(ヒドロキシメチル)-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（５００ｍｇ）のクロロホルム（１１ｍＬ）懸濁液を氷冷し、トリエチルアミン（０．７８ｍＬ）、トリメチルアミン塩酸塩（８０ｍｇ）およびｐ－トルエンスルホニルクロリド（７９８ｍｇ）を加え、１．５時間撹拌した。飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、ク

ロロホルムで抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下溶媒を留去し、残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：クロロホルム／酢酸エチル＝１００／０～３０／７０）にて精製し、4-メチルベンゼンスルホン酸 [(2S)-6-シアノ-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル（中間体１７：９１８ｍｇ）を得た。

（ｅ）製造例８と同様の方法を用いて、4-メチルベンゼンスルホン酸 [(2S)-6-シアノ-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル（中間体１７：９０７ｍｇ）から表題化合物（中間体１８：６９１ｍｇ）を得た。

[0106] 製造例１２：4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノール（中間体２３）の合成

[0107] （ａ）1-ブロモ-4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]ベンゼン（４．７２ｇ）、ビス（ピナコラート）ジボロン（５．４ｇ）、酢酸カリウム（５．２ｇ）、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（０）（３２６ｍｇ）および２－（ジシクロヘキシルホスフィノ）－２’，４’，６’－トリイソプロピルビフェニル（３４０ｍｇ）の１，４－ジオキサン（３６ｍＬ）懸濁液を１００℃で３時間撹拌した。放冷後、酢酸エチルで希釈し、不溶物をろ別し、ろ液を減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝１００／０～９２／８）にて精製し、4,4,5,5-テトラメチル-2-{4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェニル}-1,3,2-ジオキサボロラン（５．０３ｇ）を得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.01 - 1.05 (m, 2 H), 1.34 (s, 12 H), 1.34 - 1.36 (m, 2 H), 7.40 - 7.51 (m, 2 H), 7.74 - 7.82 (m, 2 H)

（ｂ）4,4,5,5-テトラメチル-2-{4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェニル}-1,3,2-ジオキサボロラン（２．５ｇ）のアセトン（３０ｍＬ）溶液を氷冷し、ペルオキシ一硫酸カリウム（７．４ｇ）の水（３０ｍＬ）溶

液を滴下した後、室温で１．５時間撹拌した。水を加え、ジエチルエーテルで抽出した後、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、表題化合物（中間体２３：８８０ｍｇ）を得た。

[0108] 製造例１３：3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノール（中間体２５）

[0109] （ａ）1-(2-フルオロ-4-メトキシフェニル)エタノン（１．００ｇ）のテトラヒドロフラン（１５ｍＬ）溶液を氷冷し、（トリフルオロメチル）トリメチルシラン（１．２７ｇ）およびテトラブチルアンモニウムフルオリド水和物（１６ｍｇ）を加え、室温で一晩撹拌した。反応液に酢酸エチルおよび１Ｍ塩酸を加え、室温で１．５時間撹拌した。分液した後、水層を酢酸エチルで抽出し、有機層を水および飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下溶媒を留去し、残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝１００／０～８０／２０）にて精製し、1,1,1-トリフルオロ-2-(2-フルオロ-4-メトキシフェニル)プロパン-2-オール（１．１０ｇ）を得た。

1H NMR (200 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.78 - 1.87 (m, 3 H), 3.81 (s, 3 H), 6.54 - 6.78 (m, 2 H), 7.46 (t, J=9.0 Hz, 1 H)

（ｂ）1,1,1-トリフルオロ-2-(2-フルオロ-4-メトキシフェニル)プロパン-2-オール（６００ｍｇ）のクロロホルム（１０ｍＬ）溶液を氷冷し、塩化チタン（IV）を加えた後、０℃で１時間、室温で一晩撹拌した。反応液を氷水に少しずつ移し、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝１００／０～９０／１０）にて精製し、1-(2-クロロ-1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル)-2-フルオロ-4-メトキシベンゼン（２１０ｍｇ）を得た。

1H NMR (200 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.19 - 2.28 (m, 3 H), 3.84 (s,

3 H), 6.64 - 6.82 (m, 2 H), 7.66 (t, J=9.2 Hz, 1 H)

（ｃ）1-(2-クロロ-1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル)-2-フルオロ-4-メトキシベンゼン（２０７ｍｇ）のヘキサン（２．０ｍＬ）溶液にトリメチルアルミニウム（１．０８Ｍヘキサン溶液、１．７ｍＬ）を加え、８５℃にて２時間加熱還流した。氷冷した後、１Ｍ塩酸を少量加え反応を停止させた。反応液に水を加え、ヘキサン／酢酸エチルで抽出し、有機層を水および飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下溶媒を留去し、残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝１００／０～８０／２０）にて精製し、2-フルオロ-4-メトキシ-1-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)ベンゼン（１７０ｍｇ）を得た。

1H NMR (200 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.57 - 1.65 (m, 6 H), 3.80 (s, 3 H), 6.54 - 6.76 (m, 2 H), 7.25 - 7.37 (m, 1 H)

（ｄ）2-フルオロ-4-メトキシ-1-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)ベンゼン（１６９ｍｇ）のクロロホルム（２．０ｍＬ）溶液を氷冷し、三臭化ホウ素（０．０７ｍＬ）を加えた。室温で１．５時間撹拌した後、氷冷し、水を加えた。クロロホルムで抽出した後、有機層を減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝１００／０～７０／３０）にて精製し、表題化合物（中間体２５：１３１ｍｇ）を得た。

[0110] 製造例１４：3,3,4,4,4-ペンタフルオロ-2-(4-メトキシフェニル)ブタン-2-オール（中間体２７）の合成

[0111] 2,2,3,3,3-ペンタフルオロ-1-(4-メトキシフェニル)プロパン-1-オン（５．３１ｇ）のジエチルエーテル溶液を氷冷し、メチルマグネシウムブロミド（３Ｍジエチルエーテル溶液、８．４ｍＬ）を加え、室温で４．５時間撹拌した。氷冷した後、メチルマグネシウムブロミド（８．４ｍＬ）を追加し、室温で一晩撹拌した。さらに３５℃で１時間撹拌した後、１Ｍ塩酸を加え、反応を停止させた。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を水お

よび飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下溶媒を留去し、残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝１００／０～７０/３０）にて精製し、表題化合物（中間体２７：５．６７ｇ）を得た。

[0112] 製造例１５：4-[2,2-ジフルオロ-1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノール（中間体２９）の合成

[0113] （ａ）1-メトキシ-4-(3,3,3-トリフルオロプロパ-1-エン-2-イル)ベンゼン（５００ｍｇ）のアセトニトリル（５．０ｍＬ）溶液にヨウ化ナトリウム（８１５ｍｇ）および（トリフルオロメチル）トリメチルシラン（１．７６ｇ）を加え、封管中１１０℃で７．５時間撹拌した。反応液に水を加え、クロロホルムで抽出した後、有機層を減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝１００／０～９０／１０）にて精製を行い。1-[2,2-ジフルオロ-1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]-4-メトキシベンゼン（５０６ｍｇ）を得た。

（ｂ）1-[2,2-ジフルオロ-1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]-4-メトキシベンゼン（１００ｍｇ）のクロロホルム（１．０ｍＬ）溶液を氷冷し、三臭化ホウ素（０．０６ｍＬ）を加え、同温で１時間、室温で１時間撹拌した。氷冷した後、反応液に飽和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、有機層を減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝１００／０～７０／３０）にて精製し、表題化合物（中間体２９：６４ｍｇ）を得た。

[0114] 製造例１６：4-(1-フェニルシクロプロピル)フェノール（中間体３３）の合成

[0115] （ａ）1-メトキシ-4-(1-フェニルエテニル)ベンゼン（４５６ｍｇ）のクロロホルム（５．０ｍＬ）溶液にジエチル亜鉛（１．１Ｍトルエン溶液、９．９ｍＬ）を加え、室温で１０分間撹拌した。反応混合物にジヨードメタン（５．８１ｇ）を加え、室温で一晩撹拌した。反応液に１Ｍ塩酸を加えた後、クロロホルムで抽出し、有機層を減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグ

ラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝１００／０～８０／２０）にて精製し、1-メトキシ-4-(1-フェニルシクロプロピル)ベンゼン（４７９ｍｇ）を得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.23 - 1.27 (m, 4 H), 3.77 (s, 3 H), 6.79 - 6.83 (m, 2 H), 7.12 - 7.25 (m, 7 H)

（ｂ）1-メトキシ-4-(1-フェニルシクロプロピル)ベンゼン（４７９ｍｇ）のクロロホルム（５．０ｍＬ）溶液を氷冷し、三臭化ホウ素（０．３ｍＬ）を加え、同温にて１時間撹拌した。反応液に飽和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、有機層を減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、ヘキサン／酢酸エチル＝１００／０～７０／３０）にて精製し、表題化合物（中間体３３：３９８ｍｇ）を得た。

[0116] 製造例１７：1-クロロ-4-(3,3-ジフルオロ-1-メチルシクロブチル)ベンゼン（中間体３４）の合成

[0117] （ａ）1-(4-クロロフェニル)-3,3-ジフルオロシクロブタンカルボン酸（１．５８ｇ）のテトラヒドロフラン（２６ｍＬ）溶液を氷冷し、ボラン－テトラヒドロフラン錯体（１．０６Ｍテトラヒドロフラン溶液、１２ｍＬ）を滴下し、同温にて２０分間撹拌の後、室温で３日間撹拌した。氷冷した後、メタノール（１２ｍＬ）を加え、１０分間撹拌した。減圧下溶媒を留去した後、残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：クロロホルム／メタノール＝１００／０～９０／１０）にて精製し、[1-(4-クロロフェニル)-3,3-ジフルオロシクロブチル]メタノール（１．４８ｇ）を得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.74 - 2.98 (m, 4 H), 3.70 - 3.77 (m, 2 H), 7.08 - 7.17 (m, 2 H), 7.31 - 7.40 (m, 2 H)

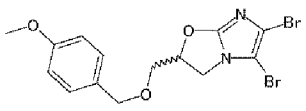
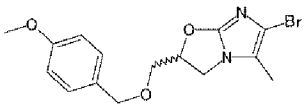
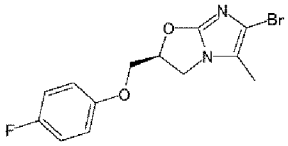
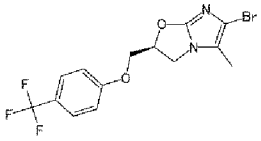
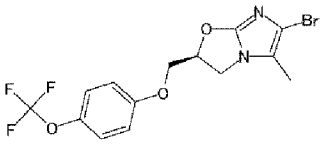
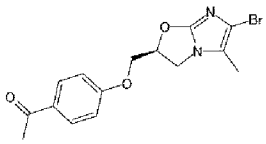
（ｂ）[1-(4-クロロフェニル)-3,3-ジフルオロシクロブチル]メタノール（１．４８ｇ）の酢酸エチル（４２ｍＬ）溶液を氷冷し、トリエチルアミン（１．３ｍＬ）およびメタンスルホニルクロリド（６４０μＬ）を加え、同温にて３０分間撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を

水および飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をテトラヒドロフラン（１２．７ｍＬ）に溶解し、氷冷した後、水素化トリエチルホウ素リチウム（１．７Ｍテトラヒドロフラン溶液、１８．７ｍＬ）を滴下した。同温にて２０分間および室温で一晩撹拌した後、氷冷し、１Ｍ塩酸を加えた。ジエチルエーテルで抽出した後、有機層を１Ｍ塩酸および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去した後、残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、ヘキサン／酢酸エチル＝１００／０～８０／２０）にて精製した。粗精製物にヘキサンを加え、生じた不溶物をろ別し、ろ液を減圧下濃縮した。得られた残渣をクロロホルムに溶解し、１Ｍ塩酸及び飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下溶媒を留去し、表題化合物（中間体３４：１．２５ｇ）を得た。

[0118] 製造例１～１７で示した中間体と、同様の方法で合成した中間体の構造式、化合物名及びそれらの機器データを表１－１～１－６に示す。表中の製造例の欄に記載された数字は、その中間体が上記製造例１～１７の内、どの製造例と同様な方法で合成されたかを示したものである。

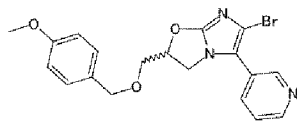
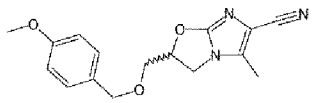
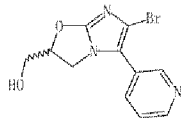
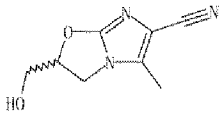
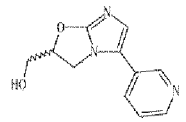
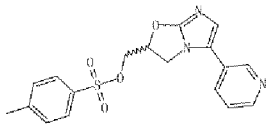
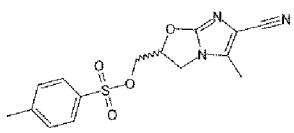
[0119]

[表1-1]

中間体	構造式	名称	機器データ	製造例
1		5,6-ジブロモ-2-{[(4-メトキシベンジル)オキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 3.69 - 3.78 (m, 2 H), 3.81 (s, 3 H), 3.99 - 4.03 (m, 1 H), 4.08 - 4.14 (m, 1 H), 4.49 - 4.56 (m, 2 H), 5.28 - 5.33 (m, 1 H), 6.87 - 6.90 (m, 2 H), 7.20 - 7.24 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 417 [M+H]+	1
2		6-ブロモ-2-{[(4-メトキシベンジル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.08 - 2.10 (m, 3 H), 3.70 - 3.74 (m, 2 H), 3.81 (s, 3 H), 3.91 - 3.95 (m, 1 H), 4.03 - 4.07 (m, 1 H), 4.49 - 4.55 (m, 2 H), 5.24 - 5.29 (m, 1 H), 6.86 - 6.90 (m, 2 H), 7.20 - 7.24 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 353 [M+H]+	1
3		(2S)-6-ブロモ-2-[(4-フルオロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.13 (s, 3 H), 4.09 (dd, J=9.5, 6.6 Hz, 1 H), 4.17 - 4.27 (m, 3 H), 5.44 - 5.51 (m, 1 H), 6.82 - 6.88 (m, 2 H), 6.95 - 7.02 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 327 [M+H]+	1
4		(2S)-6-ブロモ-5-メチル-2-{[4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.14 (s, 3 H), 4.11 (dd, J=9.3, 6.4 Hz, 1 H), 4.24 (dd, J=9.3, 8.5 Hz, 1 H), 4.32 (d, J=5.0 Hz, 2 H), 5.49 - 5.55 (m, 1 H), 6.97 (d, J=8.3 Hz, 2 H), 7.57 (d, J=8.7 Hz, 2 H); ESI/APCI MS m/z 377 [M+H]+	1
5		(2S)-6-ブロモ-5-メチル-2-{[4-(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.13 (s, 3 H), 4.09 (dd, J=9.1, 6.6 Hz, 1 H), 4.19 - 4.29 (m, 3 H), 5.46 - 5.52 (m, 1 H), 6.90 (d, J=9.1 Hz, 2 H), 7.16 (d, J=9.1 Hz, 2 H); ESI/APCI MS m/z 393 [M+H]+	1
6		1-(4-{[(2S)-6-ブロモ-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メトキシ}フェニル)エタノン	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.14 (s, 3 H), 2.57 (s, 3 H), 4.09 - 4.14 (m, 1 H), 4.21 - 4.26 (m, 1 H), 4.33 - 4.36 (m, 2 H), 5.50 - 5.55 (m, 1 H), 6.93 - 6.96 (m, 2 H), 7.93 - 7.97 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 351 [M+H]+	1

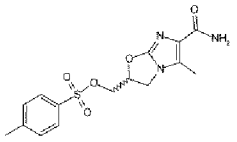
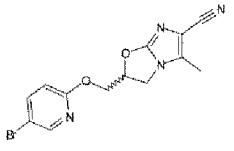
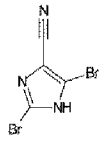
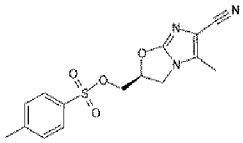
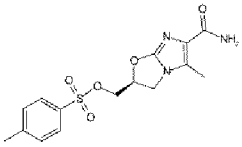
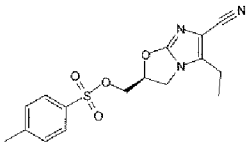
[0120]

[表1-2]

中間体	構造式	名称	機器データ	製造例
7		6-ブロモ-2-{[(4-メトキシベンジル)オキシ]メチル}-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 3.73 - 3.83 (m, 5 H), 4.12 - 4.18 (m, 1 H), 4.24 - 4.29 (m, 1 H), 4.51 - 4.57 (m, 2 H), 5.34 - 5.40 (m, 1 H), 6.86 - 6.90 (m, 2 H), 7.20 - 7.24 (m, 2 H), 7.34 - 7.37 (m, 1 H), 7.90 - 7.94 (m, 1 H), 8.52 - 8.56 (m, 1 H), 8.72 - 8.74 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 416 [M+H]+	2
8		2-{[(4-メトキシベンジル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.30 (s, 3 H), 3.70 - 3.80 (m, 2 H), 3.81 (s, 3 H), 3.99 - 4.15 (m, 2 H), 4.49 - 4.56 (m, 2 H), 5.32 - 5.38 (m, 1 H), 6.86 - 6.91 (m, 2 H), 7.18 - 7.23 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 300 [M+H]+	3
9		[6-ブロモ-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メタノール	1H NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ ppm 3.64 - 3.70 (m, 1 H), 3.75 - 3.80 (m, 1 H), 4.12 - 4.17 (m, 1 H), 4.44 - 4.49 (m, 1 H), 5.24 - 5.28 (m, 1 H), 5.34 - 5.40 (m, 1 H), 7.48 - 7.52 (m, 1 H), 7.98 - 8.00 (m, 1 H), 8.52 - 8.55 (m, 1 H), 8.80 - 8.82 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 296 [M+H]+	4
10		2-(ヒドロキシメチル)-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ ppm 2.26 (s, 3 H), 3.58 - 3.65 (m, 1 H), 3.73 - 3.79 (m, 1 H), 3.96 - 4.02 (m, 1 H), 4.20 - 4.26 (m, 1 H), 5.24 - 5.29 (m, 1 H), 5.34 - 5.40 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 180 [M+H]+	4
11		[5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メタノール	1H NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ ppm 3.16 - 3.18 (m, 1 H), 3.65 - 3.70 (m, 1 H), 3.76 - 3.81 (m, 1 H), 4.23 - 4.27 (m, 1 H), 4.53 - 4.58 (m, 1 H), 5.35 - 5.42 (m, 1 H), 7.08 (s, 1 H), 7.38 - 7.42 (m, 1 H), 7.86 - 7.90 (m, 1 H), 8.40 - 8.43 (m, 1 H), 8.74 - 8.77 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 218 [M+H]+	5
12		4-メチルベンゼンスルホン酸 [5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.46 (s, 3 H), 4.24 - 4.29 (m, 1 H), 4.33 - 4.41 (m, 2 H), 4.42 - 4.47 (m, 1 H), 5.46 - 5.51 (m, 1 H), 6.96 (s, 1 H), 7.29 - 7.34 (m, 1 H), 7.35 - 7.39 (m, 2 H), 7.65 - 7.68 (m, 1 H), 7.77 - 7.81 (m, 2 H), 8.48 - 8.51 (m, 1 H), 8.63 - 8.66 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 372 [M+H]+	6
13		4-メチルベンゼンスルホン酸 [6-シアノ-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) d ppm 2.31 (s, 3 H), 2.48 (s, 3 H), 4.07 - 4.12 (m, 1 H), 4.18 - 4.23 (m, 1 H), 4.31 - 4.35 (m, 2 H), 5.40 - 5.46 (m, 1 H), 7.37 - 7.40 (m, 2 H), 7.74 - 7.78 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 334 [M+H]+	7

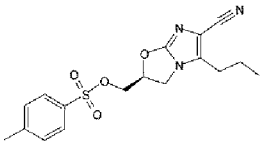
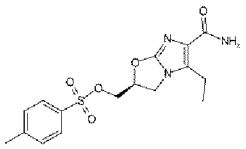
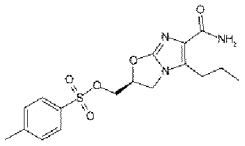
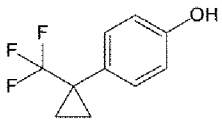
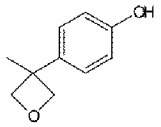
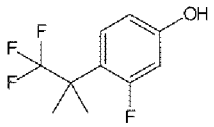
[0121]

[表1-3]

中間体	構造式	名称	機器データ	製造例
14		4-メチルベンゼンスルホン酸 (6-カルバモイル-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル)メチル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.34 (s, 3 H), 2.35 (s, 3 H), 3.88 (dd, J=9.9, 6.2 Hz, 1 H), 4.05 (dd, J=9.5, 8.7 Hz, 1 H), 4.21 (d, J=4.5 Hz, 2 H), 5.04 (br. s., 1 H), 5.24 - 5.31 (m, 1 H), 6.54 (br. s., 1 H), 7.25 (d, J=8.3 Hz, 2 H), 7.65 (d, J=8.3 Hz, 2 H)	8
15		2-{[(5-ブロモピリジン-2-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.33 (s, 3 H), 4.08 (dd, J=9.7, 6.8 Hz, 1 H), 4.24 (dd, J=9.9, 8.7 Hz, 1 H), 4.60 - 4.68 (m, 2 H), 5.58 - 5.65 (m, 1 H), 6.69 (d, J=8.3 Hz, 1 H), 7.66 - 7.73 (m, 1 H), 8.18 (d, J=2.5 Hz, 1 H)	9
16		2,5-ジブロモ-1H-イミダゾール-4-カルボニトリル	ESI/APCI MS m/z 250 [M+H]+ ESI/APCI MS m/z 248 [M-H]-	10
17		4-メチルベンゼンスルホン酸 [(2S)-6-シアノ-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.31 (s, 3 H), 2.48 (s, 3 H), 4.09 (dd, J=10.1, 6.4 Hz, 1 H), 4.21 (dd, J=9.9, 8.7 Hz, 1 H), 4.33 (d, J=4.1 Hz, 2 H), 5.38 - 5.49 (m, 1 H), 7.39 (d, J=8.3 Hz, 2 H), 7.76 (d, J=8.3 Hz, 2 H)	11
18		4-メチルベンゼンスルホン酸 [(2S)-6-カルバモイル-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.47 (s, 3 H), 2.48 (s, 3 H), 4.01 (dd, J=9.9, 6.2 Hz, 1 H), 4.18 (dd, J=9.9, 8.7 Hz, 1 H), 4.33 (d, J=4.5 Hz, 2 H), 5.15 (br. s., 1 H), 5.34 - 5.47 (m, 1 H), 6.66 (br. s., 1 H), 7.37 (d, J=7.8 Hz, 2 H), 7.78 (d, J=8.3 Hz, 2 H)	11
19		4-メチルベンゼンスルホン酸 [(2S)-6-シアノ-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.26 (t, J=7.6 Hz, 3 H), 2.47 (s, 3 H), 2.68 (q, J=7.6 Hz, 2 H), 4.05 - 4.14 (m, 1 H), 4.23 (dd, J=9.9, 8.7 Hz, 1 H), 4.30 - 4.38 (m, 2 H), 5.39 - 5.47 (m, 1 H), 7.34 - 7.42 (m, 2 H), 7.71 - 7.79 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 370 [M+Na]+	11

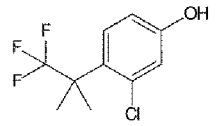
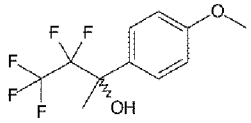
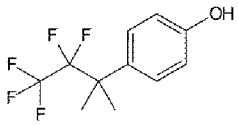
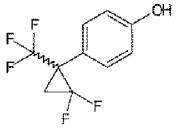
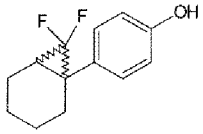
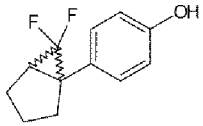
[0122]

[表1-4]

中間体	構造式	名称	機器データ	製造例
20		4-メチルベンゼンスルホン酸 [(2S)-6-シアノ-5-プロピル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.98 (t, J=7.4 Hz, 3 H), 1.60 - 1.68 (m, 2 H), 2.47 (s, 3 H), 2.57 - 2.66 (m, 2 H), 4.09 (dd, J=9.9, 6.2 Hz, 1 H), 4.21 (dd, J=9.9, 8.7 Hz, 1 H), 4.29 - 4.38 (m, 2 H), 5.39 - 5.46 (m, 1 H), 7.38 (d, J=7.8 Hz, 2 H), 7.75 (d, J=8.3 Hz, 2 H); ESI MS m/z 362 [M+H]+	11
21		4-メチルベンゼンスルホン酸 [(2S)-6-カルバモイル-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.18 (t, J=7.6 Hz, 3 H), 2.46 (s, 3 H), 2.98 (q, J=7.6 Hz, 2 H), 4.04 (dd, J=9.9, 6.6 Hz, 1 H), 4.21 (dd, J=9.7, 8.5 Hz, 1 H), 4.33 (d, J=4.1 Hz, 2 H), 5.13 (br. s., 1 H), 5.36 - 5.45 (m, 1 H), 6.73 (br. s., 1 H), 7.37 (d, J=7.8 Hz, 2 H), 7.77 (d, J=8.3 Hz, 2 H); ESI/APCI MS m/z 388 [M+Na]+	11
22		4-メチルベンゼンスルホン酸 [(2S)-6-カルバモイル-5-プロピル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.94 (t, J=7.2 Hz, 3 H), 1.52 - 1.61 (m, 2 H), 2.45 (s, 3 H), 2.86 - 2.93 (m, 2 H), 2.97 (s, 3 H), 4.00 (dd, J=9.9, 6.2 Hz, 1 H), 4.14 - 4.22 (m, 1 H), 4.31 (d, J=4.5 Hz, 2 H), 5.13 (br. s., 1 H), 5.33 - 5.42 (m, 1 H), 6.68 (br. s., 1 H), 7.35 (d, J=8.3 Hz, 2 H), 7.75 (d, J=8.7 Hz, 2 H)	11
23		4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.91 - 1.00 (m, 2 H), 1.24 - 1.35 (m, 2 H), 4.77 (br. s., 1 H), 6.72 - 6.82 (m, 2 H), 7.30 - 7.37 (m, 2 H)	12
24		4-(3-メチルオキセタン-3-イル)フェノール	1H NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ ppm 1.54 (s, 3 H), 4.44 (d, J=5.8 Hz, 2 H), 4.69 (d, J=5.8 Hz, 2 H), 6.65 - 6.72 (m, 2 H), 6.96 - 7.05 (m, 2 H), 9.26 (s, 1 H)	12
25		3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノール	1H NMR (200 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.57 - 1.67 (m, 6 H), 4.94 (s, 1 H), 6.47 - 6.70 (m, 2 H), 7.19 - 7.34 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 221 [M-H]-	13

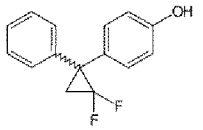
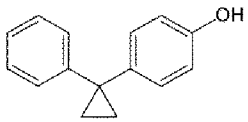
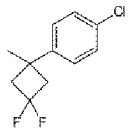
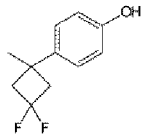
[0123]

[表1-5]

中間体	構造式	名称	機器データ	製造例
26		3-クロロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノール	1H NMR (200 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.69 - 1.79 (m, 6 H), 4.91 (s, 1 H), 6.65 - 6.78 (m, 1 H), 6.90 - 6.96 (m, 1 H), 7.35 - 7.47 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 237 [M-H]-	13
27		3,3,4,4,4-ペンタフルオロ-2-(4-メトキシフェニル)ブタン-2-オール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.80 (s, 3 H), 2.35 (s, 1 H), 3.82 (s, 3 H), 6.85 - 6.95 (m, 2 H), 7.47 (d, J=8.7 Hz, 2 H)	14
28		4-(3,3,4,4,4-ペンタフルオロ-2-メチルブタン-2-イル)フェノール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.58 (s, 6 H), 4.82 (s, 1 H), 6.76 - 6.84 (m, 2 H), 7.34 (d, J=8.7 Hz, 2 H); ESI/APCI MS m/z 253 [M-H]-	13
29		4-[2,2-ジフルオロ-1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.81 - 1.94 (m, 1 H), 2.20 - 2.35 (m, 1 H), 5.08 (s, 1 H), 6.83 - 6.87 (m, 2 H), 7.29 (d, J=8.3 Hz, 2 H); ESI/APCI MS m/z 237 [M-H]-	15
30		4-(7,7-ジフルオロビシクロ[4.1.0]ヘプタ-1-イル)フェノール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.28 - 1.49 (m, 4 H), 1.66 - 1.85 (m, 3 H), 1.92 - 2.02 (m, 1 H), 2.07 - 2.18 (m, 1 H), 4.98 (br. s., 1 H), 6.72 - 6.81 (m, 2 H), 7.10 - 7.18 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 223 [M-H]-	15
31		4-(6,6-ジフルオロビシクロ[3.1.0]ヘキサ-1-イル)フェノール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.65 - 1.78 (m, 1 H), 1.86 (d, J=9.9 Hz, 1 H), 2.06 - 2.21 (m, 4 H), 2.39 - 2.47 (m, 1 H), 4.75 (s, 1 H), 6.76 - 6.81 (m, 2 H), 7.10 - 7.15 (m, 2 H)	15

[0124]

[表1-6]

中間体	構造式	名称	機器データ	製造例
32		4-(2,2-ジフルオロ-1-フェニルシクロプロピル)フェノール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.97 - 2.10 (m, 2 H), 4.82 (s, 1 H), 6.74 - 6.81 (m, 2 H), 7.20 - 7.34 (m, 5 H), 7.36 - 7.41 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 245 [M-H]-	15
33		4-(1-フェニルシクロプロピル)フェノール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.18 - 1.30 (m, 4 H), 4.63 (s, 1 H), 6.69 - 6.75 (m, 2 H), 7.10 - 7.29 (m, 7 H); ESI/APCI MS m/z 209 [M-H]-	16
34		1-クロロ-4-(3,3-ジフルオロ-1-メチルシクロブチル)ベンゼン	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.50 (s, 3 H), 2.64 - 2.74 (m, 2 H), 2.82 - 2.94 (m, 2 H), 7.09 - 7.15 (m, 2 H), 7.27 - 7.32 (m, 2 H)	17
35		4-(3,3-ジフルオロ-1-メチルシクロブチル)フェノール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.51 (s, 3 H), 2.62 - 2.73 (m, 2 H), 2.81 - 2.97 (m, 2 H), 4.67 (s, 1 H), 6.77 - 6.83 (m, 2 H), 7.04 - 7.10 (m, 2 H)	12

[0125] 実施例１：(2S)-5-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物２）及び(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物３）の合成

(2S)-2-{[4-(tert-ブチル)フェノキシ]メチル}オキシラン（1.37 g）、2,4-ジブロモ-1H-イミダゾール（1.00 g）及び炭酸セシウム（2.16 g）のジメチルスルホキシド（30 mL）懸濁液を130 ℃で2.5時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷し、水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 70/30～20/80; v/v）で精製し、表題化合物（化合物２：118 mg, 無色固体）及び表題化合物（化合物３：356 mg, 無色固体）を得た。

[0126] 実施例２：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-クロロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物８）及び(2S)-6-ブロモ-2

-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-クロロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物９）の合成

実施例１で得られた（2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物３：400 mg）のテトラヒドロフラン（4 mL）溶液に-78 ℃でn-ブチルリチウム（2.6 M ヘキサン溶液、0.438 mL）を加え、同温で2時間撹拌した。反応液にヘキサクロロエタン（539 mg）を-78 ℃で加え、同温で1時間撹拌した後、0 ℃まで昇温させながら1.5時間撹拌した。反応混合物に室温で飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 90/10～70/30; v/v）で精製し、表題化合物（化合物８：152 mg, 無色固体）及び表題化合物（化合物９：63 mg, 黄色固体）を得た。

[0127] 実施例３：(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物１）の合成

実施例１と同様の手法を用いて得られた(2S)-5,6-ジブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物５４：400 mg）のテトラヒドロフラン（4 mL）溶液に-78 ℃でn-ブチルリチウム（2.6 M ヘキサン溶液、0.358 mL）を加え、同温で1時間撹拌した。反応液にヨードメタン（0.064 mL）を-78 ℃で加え、同温で1時間撹拌した後、室温まで昇温させながら4時間撹拌した。反応混合物に室温で飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 90/10～65/35; v/v）で精製し、表題化合物（化合物１：235 mg, 淡黄色固体）を得た。

[0128] 実施例４：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-フェニル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物６）の合成

実施例１で得られた(2S)-5-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物２：77 mg）、フェニルボロン酸（27 mg）、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(0)（25 mg）及び炭酸セシウム（86 mg）のトルエン/エタノール/水（3/3/2; v/v/v, 1 mL）懸濁液をマイクロ波照射下、100 ℃で1時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷し、水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 70/30～50/50; v/v）で精製し、表題化合物（化合物６：64 mg, 無色固体）を得た。

[0129] 実施例５：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物１１）の合成

実施例３で得られた(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物１：38 mg）、亜鉛（3 mg）、シアン化亜鉛（12 mg）、1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン（6 mg）及びトリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)（10 mg）のジメチルアセトアミド（1 mL）懸濁液を窒素雰囲気下、95 ℃で28時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷し、水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 70/30～50/50; v/v）で精製し、表題化合物（化合物１１：3 mg, 淡黄色固体）を得た。

[0130] 実施例６：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物４）の合成

実施例３で得られた(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物１：50 mg）のメタノール（2 mL）溶液に10% パラジウム炭素（10 mg）を加え、水素

雰囲気下、室温で1時間撹拌した。反応混合物をセライト（登録商標）濾過し、濾液を減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（SNAP Cartridge KP-NH、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 65/35～5/95; v/v）で精製し、表題化合物（化合物４：15 mg, 褐色固体）を得た。

[0131] 実施例７：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-クロロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物２３）の合成

実施例２で得られた(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-クロロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物９：36 mg）のテトラヒドロフラン（1 mL）溶液に-78 ℃でn-ブチルリチウム（2.6 M ヘキサン溶液、0.036 mL）を加え、同温で2時間撹拌した後、室温まで昇温させながら2.5時間撹拌した。反応混合物に室温で飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣を分取薄層クロマトグラフィー（分取用TLCプレート、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 50/50; v/v）で精製し、表題化合物（化合物２３：15 mg, 無色固体）を得た。

[0132] 実施例８：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(トリメチルシリル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物１２）の合成

（ａ）実施例１と同様の手法を用いて得られた(2S)-5,6-ジブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物５４：300 mg）のテトラヒドロフラン（3 mL）溶液に-78 ℃でn-ブチルリチウム（2.6 M ヘキサン溶液、0.282 mL）を加え、同温で30分間撹拌した。トリメチルシリルクロリド（0.093 ml）を-78 ℃で加え、同温で30分間撹拌した後、0 ℃まで昇温させながら20分間撹拌した。反応混合物に室温で飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢

酸エチル = 95/5～80/20; v/v）で精製し、(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(トリメチルシリル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（143 mg, 無色アモルファス）を得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δppm 0.34 (s, 9 H), 1.30 (s, 9 H), 4.09 - 4.30 (m, 4 H), 5.44 - 5.50 (m, 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 2 H), 7.30 - 7.34 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 423 [M+H]+

（ｂ）得られた(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(トリメチルシリル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（143 mg）のテトラヒドロフラン(1.5 ml)溶液に、-78 ℃でn-ブチルリチウム（2.6 M ヘキサン溶液、0.130 mL）を加え、同温で2時間撹拌した後、ヨードメタン(0.023 ml)を加えて0℃まで昇温させながら3時間撹拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 80/20～50/50; v/v）で精製し、淡黄色アモルファス(35 mg)を得た。得られた淡黄色アモルファス（35 mg）のメタノール（1 mL）溶液に炭酸カリウム（13 mg）を加えて、室温で95分間撹拌した。反応混合物に水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣を分取薄層クロマトグラフィー（分取用TLCプレートNH、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 33/67; v/v）で精製し無色アモルファスを得た。この無色アモルファスを分取薄層クロマトグラフィー（分取用TLCプレート、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 50/50; v/v）で精製し、表題化合物（化合物１２：16 mg, 無色固体）を得た。

[0133] 実施例９：2-[(3-フルオロフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物６５）の合成

製造例５で得られた[5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メタノール（中間体１１：28 mg）の1,4-ジオキサ

ン（1 mL）懸濁液に3-フルオロフェノール（0.014 mL）、アゾジカルボン酸ジイソプロピル（1.9 M トルエン溶液、0.136 mL）及びトリフェニルホスフィン（68 mg）を加えて、室温で20時間撹拌した。反応混合物に水及びクロロホルムを加えた後、有機層と水層を分離した。水層をクロロホルムで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣を分取薄層クロマトグラフィー（分取用TLCプレート、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 30/70; v/v）で精製し、表題化合物（化合物６５：12 mg, 無色固体）を得た。

[0134] 実施例１０：2-[(ビフェニル-4-イルオキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物９３）の合成

製造例６で得られた4-メチルベンゼンスルホン酸 [5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル（中間体１２：72 mg）のアセトニトリル（1.5 mL）溶液に4-フェニルフェノール（35 mg）及び炭酸セシウム（123 mg）を加えて、80 ℃で2時間撹拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（SNAP Cartridge HP-Sil、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 50/50～85/15 ～ クロロホルム/メタノール = 95/5～90/10; v/v）で精製し、表題化合物（化合物９３：35 mg, 無色固体）を得た。

[0135] 実施例１１：(2S)-2-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物１２４）の合成

ジイソプロピルアミン（1.12 g）のテトラヒドロフラン（20 mL）溶液に-78 ℃でn-ブチルリチウム（2.6 M ヘキサン溶液、4.3 mL）を加え、0 ℃まで昇温させながら30分間撹拌した。反応混合物に-78 ℃で実施例５と同様の手法を用いて得られた(2S)-2-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物１４４：2.04 g

）のテトラヒドロフラン（20 mL）溶液を加え、同温で30分間撹拌した。反応混合物にヨードメタン（5.25 g）を-78 ℃で加え、同温で1時間撹拌した後、室温まで昇温させながら3.5時間撹拌した。反応混合物に0 ℃で飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで1回抽出し、有機層をあわせ、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 70/30～30/70; v/v）で精製し、表題化合物（化合物１２４：1.21 g，淡黄色固体）を得た。

[0136] 実施例１２：(2S)-2-[(ビフェニル-4-イルオキシ)メチル]-5-[6-(プロパン-2-イルオキシ)ピリジン-3-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物１０８）の合成

実施例４と同様の手法を用いて得られた(2S)-2-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-5-[6-(プロパン-2-イルオキシ)ピリジン-3-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物１０１：100 mg）、フェニルボロン酸（41 mg）、(1,3-ビス(2,6-ジイソプロピルフェニル)イミダゾリデン)(3-クロロピリジル)塩化パラジウム(ＩＩ)（18 mg）及び炭酸カリウム（107 mg）のトルエン/エタノール/水（3/3/2; v/v/v, 1.0 mL）懸濁液を窒素雰囲気下、100 ℃で1時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷し、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 90/10～0/100; v/v）で精製し、表題化合物（化合物１０８：48 mg，無色固体）を得た。

[0137] 実施例１３：(2S)-2-[(ビフェニル-4-イルオキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物１２５）の合成

実施例１１で得られた(2S)-2-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物１２４：150 mg）、フェニルボロン酸（82 mg）、(1,3-ビス(2,6-ジイソプロピルフェニル)イミダゾリデン)(3-クロロピリジル)塩化パラジウム(ＩＩ)（35

mg）及び炭酸カリウム（215 mg）のトルエン/エタノール/水（3/3/2; v/v/v, 2.9 mL）懸濁液を窒素雰囲気下、100 ℃で1時間撹拌した。フェニルボロン酸（107 mg）、(1,3-ビス(2,6-ジイソプロピルフェニル)イミダゾリデン)(3-クロロピリジル)塩化パラジウム(ＩＩ)（140 mg）を加えて1時間撹拌、反応混合物を室温まで放冷してセライト（登録商標）濾過し、濾液に水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。有機層を飽和食塩水で洗浄、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 70/30～10/90; v/v）で精製し、表題化合物（化合物１２５：80 mg, 無色固体）を得た。

[0138] 実施例１４：(2S)-2-{[(2'-クロロビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物１６０）の合成

（ａ）実施例１１で得られた(2S)-2-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物１２４：600 mg）、ビス（ピナコラト）ジボロン（631 mg）、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)（95 mg）、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2',4',6'-トリイソプロピルビフェニル（197 mg）及び酢酸カリウム（609 mg）の1,4-ジオキサン（12 mL）懸濁液を窒素雰囲気下、110 ℃で21時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷してセライト（登録商標）濾過し、濾液を減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 90/10～40/60; v/v）で精製し、(2S)-5-メチル-2-{[4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（445 mg, 淡褐色アモルファス）を得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δppm 1.34 (s, 12 H), 2.34 (s, 3 H), 4.17 - 4.36 (m, 4 H), 5.56 - 5.62 (m, 1 H), 6.86 - 6.89 (m, 2 H), 7.74 - 7.78 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 382 [M+H]+

（ｂ）得られた(2S)-5-メチル-2-{[4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオ

キサボロラン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（150 mg）、2-ブロモクロロベンゼン（90 mg）、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(0)（45 mg）及び炭酸セシウム（384 mg）のトルエン/エタノール/水（3/3/2; v/v/v, 3 mL）懸濁液を窒素雰囲気下、100 ℃で1.5時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷し、水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 90/10～30/70; v/v）で精製することで淡黄色油状物を得た。この淡黄色油状物を再結晶（ヘキサン/酢酸エチル）し、表題化合物（化合物１６０：73 mg, 無色固体）を得た。

[0139] 実施例１５：(2S)-5-メチル-2-{[(4'-メチルビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（化合物１３６）の合成

実施例１３と同様の手法を用いて得られた(2S)-5-メチル-2-{[(4'-メチルビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物１３３：57 mg）のメタノール（8 mL）懸濁液に1M水酸化ナトリウム水溶液（8 mL）を加え、100 ℃で3.5日撹拌した。反応混合物を室温まで放冷し、1M塩酸で中和したのち、水及びクロロホルム/メタノール（9/1; v/v）を加えて、有機層と水層を分離した。水層をクロロホルム/メタノール（9/1; v/v）で2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣を分取薄層クロマトグラフィー（分取用TLCプレート、移動相：クロロホルム/メタノール = 90/10; v/v）で精製し、表題化合物（化合物１３６：18 mg, 無色固体）を得た。

[0140] 実施例１６：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（化合物３９）の合成

実施例５と同様の手法を用いて得られた(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニト

リル（化合物７：291 mg）のメタノール（4 mL）懸濁液に1M 水酸化ナトリウム水溶液（4 mL）を加え、85 ℃で4.5時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷し、1M塩酸で中和したのち、水及びクロロホルム/メタノール（9/1; v/v）を加えて、有機層と水層を分離した。水層をクロロホルム/メタノール（9/1; v/v）で2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣にジエチルエーテルを加えて16時間攪拌した後、析出物を濾取、乾燥し、表題化合物（化合物３９：175 mg, 無色固体）を得た。

[0141] 実施例１７：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（化合物１３９）の合成

（ａ）ジイソプロピルアミン（102 mg）のテトラヒドロフラン（2 mL）溶液に-78 ℃でn-ブチルリチウム（2.6 M ヘキサン溶液、0.39 mL）を加え、0 ℃まで昇温させながら30分間撹拌した。反応混合物に-78 ℃で実施例５と同様の手法を用いて得られた(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物７：200 mg）のテトラヒドロフラン（2 mL）溶液を加え、同温で30分間撹拌した。反応混合物にヨードエタン（525 mg）を-78 ℃で加え、同温で10分間撹拌した後、室温まで昇温させながら2時間撹拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで1回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 80/20～40/60; v/v）で精製し、(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（45 mg, 黄色油状物）を得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δppm 1.24 - 1.33 (m, 12 H), 2.72 (q, J=7.4 Hz, 2 H), 4.17 - 4.22 (m, 1 H), 4.25 - 4.30 (m, 3 H), 5.53 - 5.59 (m, 1 H), 6.80 - 6.84 (m, 2 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H); ESI MS m/z

326 [M+H]+

（ｂ）得られた(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリルに実施例１６と同様の手法を用いて表題化合物（化合物１３９）を得た。

[0142] 実施例１８：(2S)-5-ブチル-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（化合物１４０）の合成

（ａ）ヨードエタンの代わりにヨードブタンを用いて、実施例１７（ａ）と同様の手法で、(2S)-5-ブチル-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリルを得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δppm 0.96 (t, J=7.4 Hz, 3 H), 1.30 (s, 9 H), 1.37 - 1.44 (m, 2 H), 1.58 - 1.65 (m, 2 H), 2.66 - 2.71 (m, 2 H), 4.16 - 4.20 (m, 1 H), 4.23 - 4.32 (m, 3 H), 5.53 - 5.59 (m, 1 H), 6.80 - 6.83 (m, 2 H), 7.30 - 7.34 (m, 2 H); ESI MS m/z 354 [M+H]+

（ｂ）得られた(2S)-5-ブチル-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリルに実施例１６と同様の手法を用いて、表題化合物（化合物１４０）を得た。

[0143] 実施例１９：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-N,N-ジメチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（化合物４５）の合成

水酸化カリウム（103 mg）にジメチルスルホキシド（3 mL）を加えて室温で15分間攪拌した後、実施例１６で得られた(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（化合物３９：75 mg）とヨードメタン（0.030 mL）を加え、室温で18.5時間撹拌した。反応混合物に水及びクロロホルムを加えて、有機層と水層を分離した。水層をクロロホルムで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣を分取薄層クロマトグラフィー（分取用TLCプレート、移動相：酢酸エチル /メタノール = 90/10; v/v）で

精製することで無色油状物を得た。この無色油状物を再結晶（ヘキサン/ジエチルエーテル）し、表題化合物（化合物４５：8 mg，無色固体）を得た。

[0144] 実施例２０：(2S)-2-[(ビフェニル-4-イルオキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（化合物１１６）の合成

実施例１６と同様の手法を用いて得られた(2S)-2-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（化合物１０６：13 mg）、フェニルボロン酸（7 mg）、(1,3-ビス(2,6-ジイソプロピルフェニル)イミダゾリデン)(3-クロロピリジル)塩化パラジウム(ＩＩ)（3 mg）及び炭酸カリウム（17 mg）のトルエン/エタノール/水（3/3/2; v/v/v, 1 mL）懸濁液を窒素雰囲気下、100 ℃で2時間撹拌した。さらにフェニルボロン酸（7 mg）及び(1,3-ビス(2,6-ジイソプロピルフェニル)イミダゾリデン)(3-クロロピリジル)塩化パラジウム(ＩＩ)（3 mg）を加えて100 ℃で1時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷し、水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣を分取薄層クロマトグラフィー（分取用TLCプレート、移動相：クロロホルム/メタノール = 90/10; v/v）で精製し、表題化合物（化合物１１６：4 mg，無色固体）を得た。

[0145] 実施例２１：1-{(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-イル}エタノン（化合物５０）の合成

実施例１で得られた(2S)-5-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物２：100 mg）、トリブチル(1-エトキシビニル)チン（103 mg）、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(0)（33 mg）及びフッ化セシウム（43 mg）のN,N-ジメチルホルムアミド（1 mL）懸濁液を窒素雰囲気下、120 ℃で3時間撹拌した。反応混合物を氷冷したのち、1M塩酸（1 mL）を加えて、0 ℃で1時間撹拌した後

、室温まで昇温させながら12時間撹拌した。反応混合物に水、飽和食塩水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 70/30～20/80; v/v）で精製することで無色油状物を得た。この無色油状物を再結晶（ヘキサン/ジエチルエーテル）し、表題化合物（化合物５０：16 mg, 無色固体）を得た。

[0146] 実施例２２：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-(メチルスルホニル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物４２）の合成

実施例１で得られた(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物３：150 mg）、メタンスルフィン酸ナトリウム（52 mg）、L-プロリン（9.8 mg）、ヨウ化銅（Ｉ）（8.1 mg）、水酸化ナトリウム（3.4 mg）のジメチルスルホキシド（1.5 mL）懸濁液をマイクロウェーブ照射下100 ℃で1時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷し、水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで1回抽出し、有機層をあわせ、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣を分取薄層クロマトグラフィー（分取用TLCプレート、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 50/50; v/v）で精製し、表題化合物（化合物４２：7 mg, 無色固体）を得た。

[0147] 実施例２３：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルバルデヒド（化合物３７）の合成

実施例１で得られた(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物３：5.00 g）のテトラヒドロフラン（100 mL）溶液に-78 ℃でn-ブチルリチウム（2.6 M ヘキサン溶液、5.48 mL）を加え、同温で1時間撹拌した。N,N-ジメチルホルムアミド（3.12 g）を-78 ℃で加え、同温で30分撹拌した後、室温まで昇温させながら13時間撹拌した。反応混合物に室温で飽和塩化アンモニウム水溶液及

び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：酢酸エチル）で精製することで黄色固体を得た。この黄色固体に酢酸エチル/ジエチルエーテル（2 mL/11 mL）を加えて16時間攪拌した後、析出物を濾取、乾燥し、表題化合物（化合物３７：483 mg，無色固体）を得た。

[0148] 実施例２４：{(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-イル}メタノール（化合物４１）の合成

実施例２３で得られた(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルバルデヒド（化合物３７：183 mg）のエタノール（2 mL）溶液に、0 ℃で水素化ホウ素ナトリウム（23 mg）を加えて、同温で50分撹拌した。反応混合物に水、飽和食塩水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：クロロホルム/メタノール = 97/3～93/7; v/v）で精製し、表題化合物（化合物４１：54 mg，無色固体）を得た。

[0149] 実施例２５：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-(メトキシメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物５５）の合成

実施例２４で得られた{(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-イル}メタノール（化合物４１：154 mg）、炭酸ナトリウム（270 mg）のクロロホルム（2 mL）懸濁液に、0 ℃でチオニルクロリド（0.041 mL）を加えて、同温で1.5時間撹拌した。反応混合物を濾過し、濾液を減圧下濃縮した。残渣のメタノール（2 mL）溶液に、室温下でナトリウムメトキシド（8 mg）を加えて、同温で18時間撹拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液及び酢酸エチルを加えた後

、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣を分取薄層クロマトグラフィー（分取用TLCプレート、移動相：酢酸エチル）で精製し、表題化合物（化合物５５：9 mg，淡黄色固体）を得た。

[0150] 実施例２６：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-エテニル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物４４）の合成

実施例１で得られた(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物３：200 mg）、トリブチルビニルチン（0.182 mL）及びテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(0)（132 mg）のトルエン（2 mL）懸濁液を窒素雰囲気下、100 ℃で1時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷してセライト（登録商標）濾過し、濾液を減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris NH、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 80/20～70/30; v/v）で精製することで黄色固体を得た。得られた黄色固体をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 80/20～50/50; v/v）で精製し、表題化合物（化合物４４：91 mg，無色固体）を得た。

[0151] 実施例２７：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物４８）の合成

実施例２６で得られた(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-エテニル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物４４：43 mg）のメタノール（1 mL）溶液に10% パラジウム炭素（20 mg）を加え、水素雰囲気下、室温で3時間撹拌した。反応混合物をセライト（登録商標）濾過し、濾液を減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 80/20～70/30; v/v）で精製し、表題化合物（化合物４８：33 mg，無色固体）を得た。

[0152] 実施例２８：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-エテニル-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物５６）の合成

（ａ）ジイソプロピルアミン（953 mg）のテトラヒドロフラン（20 mL）溶液に-78 ℃でn-ブチルリチウム（2.6 M ヘキサン溶液、3.54 mL）を加え、0 ℃まで昇温させながら30分間撹拌した。反応混合物に-78 ℃で実施例１で得られた(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物３：2.7 g）のテトラヒドロフラン（10 mL）溶液を加え、同温で30分間撹拌した。反応混合物にヨードエタン（2.94 g）を-78 ℃で加え、同温で5分間撹拌した後、0 ℃まで昇温させながら15分間、室温まで昇温させながら一晩撹拌した。反応混合物に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 90/10～70/30; v/v）で精製し、(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（2.4 g, 黄色固体）を得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δppm 1.14 - 1.19 (m, 3 H), 1.30 (s, 9 H), 2.51 - 2.56 (m, 2 H), 4.09 - 4.14 (m, 1 H), 4.20 - 4.30 (m, 3 H), 5.45 - 5.50 (m, 1 H), 6.81 - 6.86 (m, 2 H), 7.30 - 7.33 (m, 2 H)

（ｂ）得られた(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾールに実施例２６と同様の手法を用いて、表題化合物（化合物５６）を得た。

[0153] 実施例２９：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5,6-ジエチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物６２）の合成

実施例２８で得られた(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-エテニル-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物５６）に実施例２７と同様の手法を用いて、表題化合物（化合物６２）を得た。

[0154] 実施例３０：5-メチル-2-[({5-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]ピリジン-2-イル}オキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール

-6-カルボニトリル（化合物１７１）の合成

製造例４と同様の手法を用いて得られた2-(ヒドロキシメチル)-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（中間体１０：20 mg）、2-ブロモ-5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピリジン（34 mg）、酢酸パラジウム（3 mg）、[1,1'-ビナフタレン]-2-イルジ-tert-ブチルホスフィン（5 mg）及び炭酸セシウム（109 mg）のトルエン（1 mL）懸濁液を窒素雰囲気下、110 ℃で5時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷してセライト（登録商標）濾過し、濾液を減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 90/10～70/30; v/v）で精製することで無色油状物を得た。この無色油状物を分取薄層クロマトグラフィー（分取用TLCプレート、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 50/50; v/v）で精製し、表題化合物（化合物１７１：5 mg, 無色油状物）を得た。

[0155] 実施例３１：(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-クロロ-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物７６）の合成

実施例４と同様の手法を用いて得られた(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物１３：16 mg）のクロロホルム（1 mL）溶液を氷冷し、N-クロロこはく酸イミド（7 mg）を加えて同温で40分、60 ℃で1.5時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷して、分取薄層クロマトグラフィー（分取用TLCプレート、移動相：酢酸エチル）で精製し、表題化合物（化合物７６：8 mg, 無色固体）を得た。

[0156] 実施例３２：2-[(4-シクロプロピルフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物９６）の合成

製造例６で得られた4-メチルベンゼンスルホン酸 [5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル（中間体１２：110 mg）のアセトニトリル（2.0 mL）溶液に4-シクロプロピルフェノールと4-エテニルフェノールの混合物（44 mg）及び炭酸セシウム（193 mg）を加

えて、85 ℃で2時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷し、水及びクロロホルムを加えた後、有機層と水層を分離した。水層をクロロホルムで2回抽出し、有機層をあわせ、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：クロロホルム/メタノール = 100/0～90/10; v/v）で精製し、表題化合物（化合物９６：35 mg, 無色固体）及び2-[(4-エテニルフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（12 mg, 無色固体）を得た。

2-[(4-エテニルフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δppm 4.31 - 4.45 (m, 3 H), 4.51 - 4.56 (m, 1 H), 5.14 - 5.18 (m, 1 H), 5.59 - 5.67 (m, 2 H), 6.62 - 6.69 (m, 1 H), 6.84 - 6.90 (m, 2 H), 6.99 - 7.03 (m, 1 H), 7.28 - 7.33 (m, 1 H), 7.33 - 7.38 (m, 2 H), 7.68 - 7.73 (m, 1 H), 8.47 - 8.50 (m, 1 H), 8.68 - 8.72 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 320 [M+H]+

[0157] 実施例３３：2-[(4-エチルフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物１００）の合成

実施例３２で得られた2-[(4-エテニルフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール(12 mg)のメタノール（0.5 mL）溶液に10% パラジウム炭素（5 mg）を加え、水素雰囲気下、室温で30分撹拌した。反応混合物をセライト（登録商標）濾過し、濾液を減圧下濃縮後、得られた結晶をエタノール/酢酸エチルにて洗浄し、表題化合物（化合物１００：12 mg, 淡桃色固体）を得た。

[0158] 実施例３４：5-{(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-イル}ピリジン-2(1H)-オン（化合物３８）の合成

実施例４と同様の手法を用いて得られた(2S)-5-[6-(ベンジルオキシ)ピリジン-3-イル]-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール(化合物３３：110 mg)にトリフルオロ酢酸（1.0 m

L）を加え40～45 ℃で45分間撹拌した。放冷後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えpHを8とした。水及びクロロホルムを加えて、有機層と水層を分離した。有機層を減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：クロロホルム/メタノール = 100/0～90/10; v/v）で精製し、表題化合物（化合物３８：7 mg, 無色固体）を得た。

[0159] 実施例３５：6-ブロモ-5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール（化合物１７３）の合成

（ａ）(2S)-(+)-グリシジル トシラート(2.48 g)と2,5-ジブロモ-4-メチルイミダゾール(1.00g)のN,N-ジメチルホルムアミド(20 mL)溶液に、炭酸セシウム(3.34 g)を加え、50 ℃で2時間加熱撹拌した。反応混合物を室温まで放冷し、水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、水及び飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris NH、移動相：クロロホルム/メタノール = 100/0～50/50; v/v）及びカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：クロロホルム/メタノール = 100/0～50/50; v/v）で精製し、2,4-ジブロモ-5-メチル-1-(オキシラン-2-イルメチル)-1H-イミダゾール(976 mg, 無色油状物)を得た。

1H NMR (200 MHz, CHLOROFORM-d) δppm 2.18 (s, 3 H), 2.57 - 2.66 (m, 1 H), 2.80 - 2.87 (m, 1 H), 3.17 - 3.29 (m, 1 H), 4.07 - 4.28 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 295 [M+H]+

（ｂ）得られた2,4-ジブロモ-5-メチル-1-(オキシラン-2-イルメチル)-1H-イミダゾール(795 mg)と4-(2,2,2-トリフルオロ-1,1-ジメチルエチル)フェノール(576 mg)のN,N-ジメチルホルムアミド(8.0 mL)溶液に、氷冷下、水素化ナトリウム（162 mg)を加え、70 ℃で3.5時間撹拌した。反応混合物を室温まで放冷し、氷冷下水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、水及び飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラ

フィー（Reveleris NH、移動相：クロロホルム/メタノール = 90/10～50/50; v/v）で精製し、表題化合物（化合物１７３：752 mg, 無色固体）を得た。

[0160] 実施例３６：5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物１８０）の合成

製造例７で得られた4-メチルベンゼンスルホン酸 [6-シアノ-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メチル（中間体１３：130 mg）のアセトニトリル（2.6 mL）溶液に4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノール（88 mg）及び炭酸セシウム（254 mg）を加えて、80 ℃で3.5時間撹拌した。反応混合物を減圧下濃縮し、水及び酢酸エチルを加えた後、有機層と水層を分離した。水層を酢酸エチルで2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：ヘキサン/酢酸エチル = 50/50～40/60; v/v）及び分取HPLCで精製し、表題化合物（化合物１８０：79 mg, 無色アモルファス）を得た。

[0161] 実施例３７：5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（化合物１８１）の合成

実施例３６で得られた5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物１８０：55 mg）の1,4-ジオキサン（1 mL）懸濁液に2M水酸化ナトリウム水溶液（1 mL）を加え、100 ℃で2.5日撹拌した。反応混合物を室温まで放冷し、1M塩酸水溶液で中和したのち、水及びクロロホルム/メタノール（9/1; v/v）を加えて、有機層と水層を分離した。水層をクロロホルム/メタノール（9/1; v/v）で2回抽出し、有機層をあわせ、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Reveleris、移動相：クロロホルム/メタノール = 100/0～95/5; v/v）で精製し、表題化合物（化合物１８１：29 mg, 無色固体）を得た。

[0162] 実施例３８：2-{[4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２１０）の合成

2-[(4-アセチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（２０ｍｇ）のテトラヒドロフラン（１ｍＬ）溶液をドライアイス／アセトン浴で冷却し、メチルマグネシウムブロミド（約３Mテトラヒドロフラン溶液，０．０４５ｍＬ）を滴下した。同温にて３０分、氷冷下４０分、室温で２．５時間、５０℃で１時間撹拌した後、さらにメチルマグネシウムブロミド（０．０４５mL）を追加し、３時間撹拌した。室温まで昇温し、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した後、溶媒を減圧下留去した。残渣を分取薄層クロマトグラフィー（分取用TLCプレート、移動相：クロロホルム／メタノール＝９０／１０；ｖ／ｖ）および分取HPLCにて精製し、表題化合物（化合物２１０：８ｍｇ，無色固体）を得た。

[0163] 実施例３９：5-メチル-2-({[5-(トリフルオロメチル)ピリミジン-2-イル]オキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２１７）の合成

2-(ヒドロキシメチル)-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（５０ｍｇ）および２－クロロ－５－（トリフルオロメチル）ピリジン（６２ｍｇ）のＤＭＦ（１．０ｍＬ）溶液を氷冷し、水素化ナトリウム（約６０％，１４ｍｇ）を加え、１時間撹拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え反応を停止し、水を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を減圧下濃縮した後、残渣を分取ＨＰＬＣにて精製し、表題化合物（化合物２１７：８０ｍｇ，無色固体）を得た。

[0164] 実施例４０：(2S)-5-エチル-2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（化合物２５３）の合成

(2S)-5-エチル-2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン

-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（２４６ｍｇ）のジメチルスルホキシド（１．２ｍＬ）溶液に炭酸カリウム（１７１ｍｇ）を加えた。氷冷した後、反応液に過酸化水素水（約３５％、０．６ｍＬ）を加え、室温で４時間撹拌した。さらに過酸化水素水（１．２ｍＬ）を加え、室温で一晩撹拌した。氷冷した後、チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、反応を停止させた。反応液に水を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を減圧下濃縮した後、残渣を分取ＨＰＬＣにて精製し、表題化合物（化合物２５３：１３５ｍｇ，無色固体）を得た。

[0165] 実施例４１：(2S)-5-(2-フルオロエチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２３９）の合成

（ａ）後述の実施例４８と同様の方法を用いて合成した(2S)-5-ブロモ-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２５０：１２６ｍｇ）のテトラヒドロフラン（２．５ｍＬ）溶液を－７８℃に冷却し、ｎ－ブチルリチウム（２．６４Ｍヘキサン溶液、１４４μＬ）を加え、同温にて３０分撹拌した。エチレンオキシド（１．４Ｍトルエン溶液、６２７μＬ）を加え、同温にて３０分撹拌した。徐々に昇温しながら２時間撹拌した後、飽和塩化アンモニウム水溶液を加えた。水を加え、クロロホルムで抽出した後、有機層を減圧下濃縮した。残渣を分取ＨＰＬＣにて精製し、(2S)-5-(2-ヒドロキシエチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（１１ｍｇ）を得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.51 - 1.56 (m, 6 H), 2.92 (t, J=5.6 Hz, 2 H), 3.92 (t, J=5.6 Hz, 2 H), 4.22 - 4.44 (m, 5 H), 5.50 - 5.60 (m, 0 H), 6.79 - 6.93 (m, 2 H), 7.34 - 7.48 (m, 2 H)

（ｂ）(2S)-5-(2-ヒドロキシエチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]

オキサゾール-6-カルボニトリル（１１ｍｇ）のクロロホルム（２２６μＬ）溶液に三フッ化Ｎ，Ｎ－ジエチルアミノ硫黄（４．２μＬ）を加え、５時間撹拌した。反応液を分取ＨＰＬＣにて精製し、表題化合物（化合物２３９：２．８ｍｇ，無色アモルファス）を得た。

[0166] 実施例４２：5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミドの光学分割

実施例３７で得られた5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（化合物１８１：４８０ｍｇ）を前述のラセミ体分析条件（Ｒｔ１＝５．２ｍｉｎ、Ｒｔ２＝６．１ｍｉｎ）に基づきセミ分取カラムを用いて分割し、相対保持時間が短い化合物２４０（Ｒｔ１＝５．２ｍｉｎ、２４７ｍｇ）および相対保持時間が長い化合物２３８（Ｒｔ２＝６．１ｍｉｎ、２４１ｍｇ）を得た。

[0167] 実施例４３：5-メチル-2-({4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミドの合成および光学分割

（ａ）製造例８で得られた4-メチルベンゼンスルホン酸（6-カルバモイル-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル)メチル（中間体１４、３４２ｍｇ）および製造例１２で得られた4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノール（中間体２３、１９７ｍｇ）のアセトニトリル（６．８ｍＬ）溶液に炭酸セシウム（６３４ｍｇ）を加え、８０℃で３時間撹拌した。放冷後、不溶物をろ別し、ろ液を減圧下濃縮した。残渣を分取ＨＰＬＣにて精製し、5-メチル-2-({4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（２０２ｍｇ、無色固体）を得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.94 - 1.03 (m, 2 H), 1.28 - 1.37 (m, 2 H), 2.52 (s, 3 H), 4.14 (dd, J=9.7, 6.4 Hz, 1 H), 4.20 - 4.3

4 (m, 3 H), 5.14 (br. s., 1 H), 5.49 - 5.61 (m, 1 H), 6.82 - 6.92 (m, 2 H), 7.39 (d, J=8.7 Hz, 2 H)

（ｂ）5-メチル-2-({4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（４００ｍｇ）を前述のラセミ体分析条件（Ｒｔ１＝５．５ｍｉｎ、Ｒｔ２＝６．３ｍｉｎ）に基づきセミ分取カラムを用いて分割し、相対保持時間が短い化合物２４１（Ｒｔ１＝５．５ｍｉｎ、１３９ｍｇ）を得た。

[0168] 実施例４４：2-{[3-クロロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミドの光学分割

実施例１５と同様の手法を用いて得られた2-{[3-クロロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（化合物２３５：４０ｍｇ）を前述のラセミ体分析条件（Ｒｔ１＝４．６ｍｉｎ、Ｒｔ２＝５．９ｍｉｎ）に基づきセミ分取カラムを用いて分割し、相対保持時間が短い化合物２４２（Ｒｔ１＝４．６ｍｉｎ、１８ｍｇ）を得た。

[0169] 実施例４５：2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミドの光学分割

実施例１５と同様の手法を用いて得られた2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（化合物２３４：４０ｍｇ）を前述のラセミ体分析条件（Ｒｔ１＝４．３ｍｉｎ、Ｒｔ２＝５．１ｍｉｎ）に基づきセミ分取カラムを用いて分割し、相対保持時間が短い化合物２４４（Ｒｔ１＝４．３ｍｉｎ、２２ｍｇ）を得た。

[0170] 実施例４６：2-{[4-(2-シアノプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミドの合成および光学分割

（ａ）中間体１４（１０９ｍｇ）および2-(4-ヒドロキシフェニル)-2-メチルプロパンニトリル（７５ｍｇ）のアセトニトリル（２．２ｍＬ）溶液に炭酸セシウム（２０１ｍｇ）を加え、８０℃で３時間撹拌した。放冷後、不溶物をろ別し、ろ液を減圧下濃縮した。残渣を分取ＨＰＬＣにて精製し、2-{[4-(2-シアノプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（無色固体）を得た。

（ｂ）（ａ）の方法で得られた2-{[4-(2-シアノプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（１０９ｍｇ）を前述のラセミ体分析条件（Ｒｔ１＝４．８ｍｉｎ、Ｒｔ２＝７．０ｍｉｎ）に基づきセミ分取カラムを用いて分割し、相対保持時間が短い化合物２４５（Ｒｔ１＝４．８ｍｉｎ、９ｍｇ）を得た。

[0171] 実施例４７：2-{[(1,1-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミドの合成および光学分割

（ａ）中間体１４（１１３ｍｇ）および1,1-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-オール（６３ｍｇ）のアセトニトリル（２．３ｍＬ）溶液に炭酸セシウム（２１０ｍｇ）を加え、８０℃で５時間撹拌した。放冷後、不溶物をろ別し、ろ液を減圧下濃縮した。残渣を分取ＨＰＬＣにて精製し、2-{[(1,1-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（７７ｍｇ、無色固体）を得た。

（ｂ）（ａ）の方法を用いて得られた2-{[(1,1-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド（７３ｍｇ）を前述のラセミ体分析条件（Ｒｔ１＝３．５ｍｉｎ、Ｒｔ２＝４．２ｍｉｎ）に基づきセミ分取カラムを用いて分割し、相対保持時間が短い化合物２４６（Ｒｔ１＝３．５ｍｉｎ、３６ｍｇ）を得た。

[0172] 実施例４８：((2S)-5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパ

ン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２４３）の合成

（ａ）4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノール（６．７３ｇ）を水（１６．８ｍＬ）に溶かし、水酸化ナトリウム（１．４５ｇ）および(2R)-2-(クロロメチル)オキシラン（５．２ｍＬ）を加え、７０℃で１３時間撹拌した。放冷後、反応液に水を加え、クロロホルムで抽出した後、有機層を減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（ＹＭＣ－ＮＨ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝１００／０～８５／１５；ｖ／ｖ）にて精製し、(2S)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}オキシラン（５．０３ｇ、無色油状物）を得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.75 (dd, J=5.0, 2.9 Hz, 1 H), 2.90 (t, J=4.5 Hz, 1 H), 3.28 - 3.39 (m, 1 H), 3.96 (dd, J=10.9, 5.6 Hz, 1 H), 4.21 (dd, J=10.9, 3.1 Hz, 1 H), 6.84 - 6.93 (m, 2 H), 7.40 (d, J=8.7 Hz, 2 H)

（ｂ）(2S)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}オキシラン（５．０３ｇ）および2-ブロモ-5-メチル-1H-イミダゾール-4-カルボニトリル（４．３１ｇ）のエタノール溶液に酢酸ナトリウム（３．１７ｇ）を加え、９０℃で５時間撹拌した。放冷後、溶媒を減圧下留去した後、水を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を減圧下濃縮した後、得られた残渣をＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（５２ｍＬ）に溶解し、氷冷下、水素化ナトリウム（約６０％、０．９６ｇ）を加え、室温で２時間撹拌した。再度氷冷し、反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、反応を停止させた。反応液に水を加え、酢酸エチル／トルエン（５：１）にて抽出した後、有機層を減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（ＳＮＡＰ　Ｃａｒｔｒｉｄｇｅ　ＫＰ－ＮＨ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝８０／２０～２０／８０；ｖ／ｖ、およびＲｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：クロロホルム／酢酸エチル＝８０／２０～６０／４０；ｖ／ｖ）にて精製した。粗精製物のうち一部を分取ＨＰＬＣにて精製し、表題化合物（化合物２４

３：２３３ｍｇ、無色アモルファス）を得た。

[0173] 実施例４９：(2S)-5-シクロプロピル-2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２５２）の合成

実施例４８と同様の手法を用いて得られた(2S)-5-ブロモ-2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２４９：７９５ｍｇ）のテトラヒドロフラン（１２ｍＬ）溶液にシクロプロピル亜鉛臭化物（０．５Ｍテトラヒドロフラン溶液、５．３ｍＬ）およびテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム（０）（２０５ｍｇ）を加え、マイクロ波照射下、１００℃で１時間撹拌した。放冷後、反応液を減圧下濃縮し、残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：クロロホルム／酢酸エチル＝８５／１５～６０／４０；ｖ／ｖ）および分取ＨＰＬＣにて精製し、表題化合物（化合物２５２：３０５ｍｇ、無色アモルファス）を得た。

[0174] 実施例５０：(2S)-2-[(4-tert-ブチル-3-フルオロフェノキシ)メチル]-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２５７）の合成

実施例４８と同様の方法を用いて得られた(2S)-5-ブロモ-2-[(4-tert-ブチル-3-フルオロフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２５６：４１５ｍｇ）のテトラヒドロフラン（４．２ｍＬ）溶液を－７８℃に冷却し、ｎ－ブチルリチウム（２．６９Ｍヘキサン溶液、０．３９ｍＬ）を滴下した。同温にて３０分撹拌した後、ヨウ化エチル（８１９ｍｇ）を加え、同温にて１時間、さらに０℃で３０分撹拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えた後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。乾燥剤をろ別後、減圧下濃縮し、残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝９０

／１０～５０／５０；ｖ／ｖ）にて精製し、表題化合物（化合物２５７：９９ｍｇ）および(2S)-2-[(4-tert-ブチル-3-フルオロフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２５９：３０ｍｇ）を得た。

[0175] 実施例５１：(2S)-5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボン酸（化合物２６４）の合成

化合物２４０（５０ｍｇ）のトリフルオロ酢酸／水（２６０μＬ／１３０μＬ）溶液に亜硝酸ナトリウム（３２ｍｇ）を加え、室温で２時間撹拌した。反応液に水を加え、１０％メタノール／クロロホルム溶液で抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下濃縮した後、残渣を分取ＨＰＬＣで精製し、表題化合物（化合物２６４：２１ｍｇ、無色アモルファス）を得た。

[0176] 実施例５２：(2S)-5-[(1E)-プロパ-1-エン-1-イル]-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２６９）の合成

実施例４８と同様の方法を用いて得られた(2S)-5-ブロモ-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２５０：１３６ｍｇ）の１，４－ジオキサン（２．７ｍＬ）溶液にフッ化セシウム（１４４ｍｇ）、トリス（ジベンジリデンアセトン）ジパラジウム（０）（２９ｍｇ）、トリーｔｅｒｔーブチルホスフィン（７．４μＬ）およびアリルトリブチルスズ（１４６μＬ）を加え、１００℃で一晩撹拌した。放冷後、反応液に水を加え、クロロホルムで抽出した後、有機層を減圧下濃縮した。残渣を分取ＨＰＬＣにて精製し、表題化合物（化合物２６９：１６ｍｇ）を得た。

[0177] 実施例５３：(2S)-5-(トリフルオロメチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２７９）の合成

化合物２５０（１０２ｍｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１．５ｍＬ）溶液に２，２－ジフルオロ－２－（フルオロスルホニル）酢酸メチルエステル（１５２μＬ）およびヨウ化銅（２２７ｍｇ）を加え、マイクロ波照射下１６０℃で４５分間撹拌した。放冷後、不溶物をろ別し、ろ液を分取ＨＰＬＣにて精製し、表題化合物（化合物２７９：６０ｍｇ）を得た。

[0178] 実施例５４：(2S)-5-(3-ヒドロキシプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２８２）の合成

（ａ）実施例４と同様の方法を用いて、化合物２５０（２０７ｍｇ）から(2S)-5-[(1E)-3-{[tert-ブチル(ジメチル)シリル]オキシ}プロパ-1-エン-1-イル]-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（１４５ｍｇ）を得た。

（ｂ）(2S)-5-[(1E)-3-{[tert-ブチル(ジメチル)シリル]オキシ}プロパ-1-エン-1-イル]-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（１４５ｍｇ）のメタノール（２．９ｍＬ）溶液にパラジウム－活性炭（２９ｍｇ）を加え、水素雰囲気下、３日間撹拌した。ＬＣ／ＭＳ分析より、この時点でｔｅｒｔ－ブチルジメチルシリル基が除去された化合物の生成が確認された。反応液をろ過し、ろ液を減圧下濃縮した後、残渣を分取ＨＰＬＣにて精製し、表題化合物（化合物２８２：６８ｍｇ）を得た。

[0179] 実施例５５：(2S)-5-メチル-2-({[1-(プロパン-2-イル)-1H-インドール-5-イル]オキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２８９）の合成

（ａ）実施例１０と同様の方法を用いて、中間体１７（４０ｍｇ）から(2S)-2-[(1H-インドール-5-イルオキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（１３ｍｇ）を得た。

（ｂ）(2S)-2-[(1H-インドール-5-イルオキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒ

ドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（１３ｍｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（０．５ｍＬ）溶液に水素化ナトリウム（約６０％、４ｍｇ）を加え、５分間撹拌した。２－ヨードプロパン（８ｍｇ）を加え、一晩撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、有機層を水および飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥し、溶媒を減圧下留去した後、残渣をカラムクロマトグラフィー（ＳＮＡＰ　Ｃａｒｔｒｉｄｇｅ　ＨＰ－Ｓｉｌ、移動相：クロロホルム／メタノール＝１００／０～９０／１０；ｖ／ｖ）にて精製し、表題化合物（化合物２８９：６ｍｇ）を得た。

[0180] 実施例５６：(2S)-5-(3-クロロプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２９０）の合成

実施例５４で得られた化合物２８２（９２ｍｇ）のピリジン（１．８ｍＬ）溶液に塩化チオニル（３３μＬ）を加え、５時間撹拌した。反応液を分取ＨＰＬＣにて精製し、表題化合物（化合物２９０：１６ｍｇ）を得た。

[0181] 実施例５７：(2S)-5-(3,3-ジフルオロプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２９１）の合成

（ａ）化合物２８２（１０９ｍｇ）のクロロホルム（１．１ｍＬ）溶液に1,1,1-トリアセトキシ-1,1-ジヒドロ-1,2-ベンゾヨードキソール-3-(1H)-オン（１７０ｍｇ）を加え、１時間撹拌した。1,1,1-トリアセトキシ-1,1-ジヒドロ-1,2-ベンゾヨードキソール-3-(1H)-オン（３３９ｍｇ）を追加し、さらに５時間撹拌した。反応液を氷冷した後、チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、反応を停止した。反応液に水を加え、クロロホルムで抽出し、有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄した。有機層を減圧下濃縮し、(2S)-5-(3-オキソプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（６８ｍｇ）を得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.56 (s, 6 H), 2.88 - 3.03 (m, 4 H), 4.24 - 4.38 (m, 4 H), 5.50 - 5.65 (m, 1 H), 6.81 - 6.92 (m, 2 H), 7.37 - 7.49 (m, 2 H), 9.82 (s, 1 H)

（ｂ）(2S)-5-(3-オキソプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（６８ｍｇ）のクロロホルム（２．７ｍＬ）溶液に三フッ化Ｎ，Ｎ－ジエチルアミノ硫黄（８８μＬ）を加え、２時間撹拌した。反応液に水を加え、クロロホルムで抽出した後、有機層を減圧下濃縮した。残渣を分取ＨＰＬＣにて精製し、表題化合物（化合物２９１、２０ｍｇ）を得た。

[0182] 実施例５８：(2S)-5-(3-エトキシプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２９２）

化合物２８２（１０５ｍｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（２．１ｍＬ）溶液に水素化ナトリウム（約６０％、１５ｍｇ）およびヨウ化エチル（４１μＬ）を加え、４時間撹拌した。水素化ナトリウム（約６０％、３１ｍｇ）およびヨウ化エチル（８２μＬ）を追加し、一晩撹拌した。氷冷した後、反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、反応を停止した。反応液に水を加え、クロロホルムで抽出し、有機層を減圧下濃縮した。残渣を分取ＨＰＬＣにて精製し、表題化合物（化合物２９２、６６ｍｇ）を得た。

[0183] 実施例５９：(2S)-5-(シクロプロピルカルボニル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２９８）の合成

（ａ）化合物２５０（５００ｍｇ）のテトラヒドロフラン（５．８ｍＬ）溶液を－７８℃に冷却し、ｎ－ブチルリチウム（２．６４Ｍヘキサン溶液、０．５３ｍＬ）を加え、１時間撹拌した。シクロプロパンカルボキシアルデヒド（１７４μＬ）を加え、－７８℃で３０分間、０℃で３０分間撹拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて反応を停止した後、水を加

え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下留去した後、残渣をカラムクロマトグラフィー（ＳＮＡＰ　Ｃａｒｔｒｉｄｇｅ　ＫＰ－ＮＨ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝２０／８０～０／１００；ｖ／ｖ）にて精製し、(2S)-5-[シクロプロピル(ヒドロキシ)メチル]-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（３６６ｍｇ）を得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.45 - 0.61 (m, 2 H), 0.65 - 0.78 (m, 2 H), 1.20 - 1.27 (m, 1 H), 1.55 (s, 6 H), 2.68 - 2.78 (m, 1 H), 4.18 - 4.24 (m, 1 H), 4.27 - 4.53 (m, 4 H), 5.54 - 5.65 (m, 1 H), 6.84 - 6.94 (m, 2 H), 7.40 - 7.46 (m, 2 H)

（ｂ）(2S)-5-[シクロプロピル(ヒドロキシ)メチル]-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（３０ｍｇ）のクロロホルム（０．７ｍＬ）溶液を氷冷した後、1,1,1-トリアセトキシ-1,1-ジヒドロ-1,2-ベンゾヨードキソール-3-(1H)-オン（４５ｍｇ）を加え、室温で２時間撹拌した。反応液に飽和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、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去した後、残渣を分取ＨＰＬＣにて精製し、表題化合物（化合物２９８：５．３ｍｇ）を得た。

[0184] 実施例６０：3-[(2S)-6-シアノ-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-イル]プロパン酸（化合物３０２）の合成

化合物２８２（１４６ｍｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１．５ｍＬ）溶液にニクロム酸ピリジニウム（２６８ｍｇ）を加え、一晩撹拌した。反応液にクロロホルムと水酸化ナトリウム水溶液を加え分液した。水層にクエン酸を加えてｐＨを５付近にした後、クロロホルムで抽出した。有機層を減圧下濃縮した後、残渣を分取ＨＰＬＣで精製し、表題化合物（化合物３０

２：６６ｍｇ）を得た。

[0185] 実施例６１：(2S)-5-(ジフルオロメチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物２２５）の合成

（ａ）化合物２５０（２００ｍｇ）のテトラヒドロフラン（４ｍＬ）溶液を－７８℃に冷却し、ｎ－ブチルリチウム（２．６６Mヘキサン溶液、０．１８ｍＬ）を加え、１０分間撹拌した。Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（１０２ｍｇ）を加え、０℃で１５分間撹拌した。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後、有機層を飽和食塩水で洗浄した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下溶媒を留去し、残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝７０／３０～５０／５０；ｖ／ｖ）にて精製し、(2S)-5-ホルミル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（１０４ｍｇ）を得た。

1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.56 (s, 6 H), 4.27 - 4.46 (m, 2 H), 4.52 - 4.67 (m, 2 H), 5.70 - 5.79 (m, 1 H), 6.82 - 6.90 (m, 2 H), 7.38 - 7.48 (m, 2 H), 9.79 (s, 1 H)

（ｂ）(2S)-5-ホルミル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（２１０ｍｇ）のクロロホルム（８．４ｍＬ）溶液を氷冷し、ビス(2-メトキシエチル)アミノサルファートリフルオリド（１４７ｍｇ）を加え、同温にて３０分間、室温で１６．５時間撹拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えた後、クロロホルムで抽出し、有機層を減圧下濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ　ＮＨ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝９５／５～７５／２５；ｖ／ｖ、およびＲｅｖｅｌｅｒｉｓ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝７０／３０～５０／５０；ｖ／ｖ）にて精製し、表題化合物（化合物２２５、１８ｍｇ）を得

た。

[0186] 実施例６２：(2S)-2-{[4-(7,7-ジフルオロビシクロ[4.1.0]ヘプタ-1-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミドの光学活性体（化合物３２２および化合物３２３）の合成

製造例１５と同様の方法で得られた4-(7,7-ジフルオロビシクロ[4.1.0]ヘプタ-1-イル)フェノール（中間体３０：４１ｍｇ）を前述のラセミ体分析条件（Ｒｔ１＝２．１ｍｉｎ、Ｒｔ２＝２．３ｍｉｎ）に基づきセミ分取カラムを用いて分割を行った。それぞれの異性体（保持時間が短い異性体：１７ｍｇ、保持時間が長い異性体：１３ｍｇ）と製造例１１で得られた中間体１８（２７ｍｇ、２０ｍｇ）を用いて、実施例１０と同様の方法により反応を行った。保持時間が短いフェノール（Ｒｔ１＝２．１ｍｉｎ）から化合物３２３（１６ｍｇ）を得た。また保持時間が長いフェノール（Ｒｔ２＝２．３ｍｉｎ）から化合物３２２（１８ｍｇ）を得た。

[0187] 実施例６３：(2S)-5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物３３７）の合成

実施例６１（ａ）で得られた(2S)-5-ホルミル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（５０ｍｇ）、ジメチルアミン（２Ｍテトラヒドロフラン溶液、０．１３２ｍＬ）、酢酸（１５μＬ）のクロロホルム（０．３ｍＬ）溶液を室温で１時間撹拌した。反応液にトリアセトキシボロヒドリド（５６ｍｇ）を加え、室温で６時間撹拌した。反応液に６Ｍ水酸化ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムで抽出した。有機層を減圧下濃縮し、残渣を分取薄層クロマトグラフィー（分取用ＮＨ-ＴＬＣプレート、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝４０／６０；ｖ／ｖ、および分取用ＴＬＣプレート、移動相：酢酸エチルのみ）にて精製し、表題化合物（化合物３３７：１４ｍｇ）を得た。

[0188] 実施例６４：(2S)-2,5-ジメチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル（化合物３４８）の合成

（ａ）R-2-メチルグリシジル-p-ノシラート（５．０ｇ）および2-ブロモ-5-メチル-1H-イミダゾール-4-カルボニトリル（３．４ｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（２５ｍＬ）溶液に炭酸カリウム（３．３ｇ）を加え、５０℃で５．５時間撹拌した。放冷後、不溶物をろ別し、ろ液に水を加え、トルエンで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去した後、残渣をカラムクロマトグラフィー（Ｒｅｖｅｌｅｒｉｓ　ＮＨ、移動相：ヘキサン／酢酸エチル＝１００／０～４０／６０；ｖ／ｖ）にて精製し、2-ブロモ-5-メチル-1-{[(2S)-2-メチルオキシラン-2-イル]メチル}-1H-イミダゾール-4-カルボニトリル（１．９３ｇ）を得た。

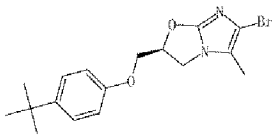
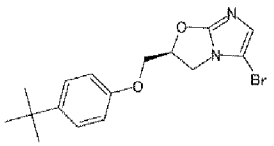
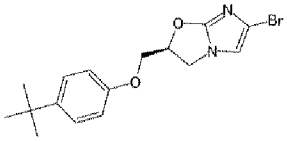
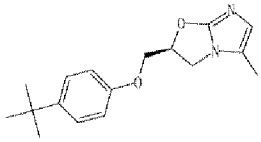
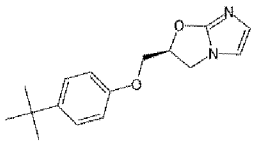
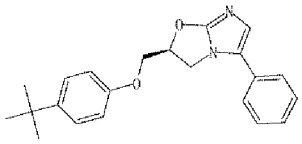
1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.39 (s, 3 H), 2.39 (d, J=4.1 Hz, 1 H), 2.43 (s, 3 H), 2.66 (d, J=4.1 Hz, 1 H), 4.03 (d, J=15.3 Hz, 1 H), 4.23 (d, J=15.3 Hz, 1 H)

（ｂ）4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノール（１９１ｍｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（２ｍＬ）溶液を氷冷し、水素化ナトリウム（約６０％、３５ｍｇ）を加え、３０分間撹拌した。反応液に2-ブロモ-5-メチル-1-{[(2S)-2-メチルオキシラン-2-イル]メチル}-1H-イミダゾール-4-カルボニトリル（２００ｍｇ）のＮ，Ｎ－ジメチルホルムアミド（２ｍＬ）溶液を加え、５０℃で４．５時間撹拌した。氷冷の後、飽和塩化アンモニウム水溶液及および水を加え、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した後、減圧下溶媒を留去し、残渣を分取ＨＰＬＣにて精製し、表題化合物（化合物３４８：１７１ｍｇ）を得た。

[0189] 実施例１～６４で示した化合物と、同様の方法で合成した化合物の構造式、化合物名及びそれらの機器データを表２－１～２－５９に示す。表中の実施例の欄に記載された数字は、その化合物が上記実施例１～６４の内、どの

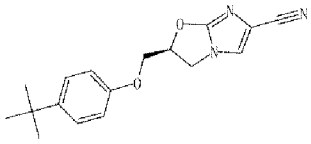
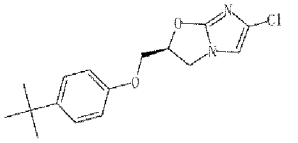
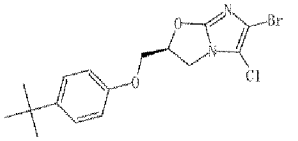
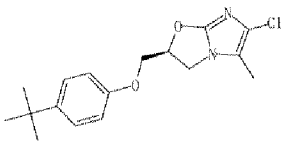
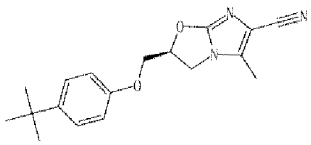
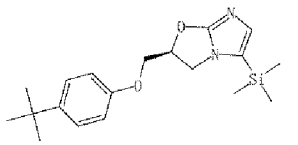
実施例と同様な方法で合成されたかを示したものである。

[0190] [表2-1]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
1		(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 2.12 (s, 3 H), 4.07 - 4.14 (m, 1 H), 4.18 - 4.25 (m, 2 H), 4.26 - 4.30 (m, 1 H), 5.44 - 5.51 (m, 1 H), 6.81 - 6.86 (m, 2 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 365 [M+H]+	3
2		(2S)-5-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.11 - 4.16 (m, 1 H), 4.21 - 4.33 (m, 3 H), 5.51 - 5.57 (m, 1 H), 6.60 (s, 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 2 H), 7.30 - 7.35 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 351 [M+H]+	1
3		(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 4.16 - 4.20 (m, 1 H), 4.23 - 4.30 (m, 3 H), 5.46 - 5.52 (m, 1 H), 6.61 (s, 1 H), 6.81 - 6.85 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 351 [M+H]+	1
4		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 2.14 (s, 3 H), 4.02 - 4.06 (m, 1 H), 4.14 - 4.23 (m, 2 H), 4.28 - 4.32 (m, 1 H), 5.47 - 5.52 (m, 1 H), 6.33 (s, 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 2 H), 7.30 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 287 [M+H]+	6
5		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.12 - 4.18 (m, 1 H), 4.21 - 4.32 (m, 3 H), 5.48 - 5.54 (m, 1 H), 6.59 (s, 1 H), 6.69 (s, 1 H), 6.82 - 6.86 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 273 [M+H]+	1
6		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-フェニル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 4.28 - 4.40 (m, 3 H), 4.48 - 4.52 (m, 1 H), 5.57 - 5.62 (m, 1 H), 6.84 - 6.87 (m, 2 H), 6.93 (s, 1 H), 7.22 - 7.26 (m, 1 H), 7.30 - 7.33 (m, 2 H), 7.35 - 7.42 (m, 4 H); ESI/APCI MS m/z 349 [M+H]+	4

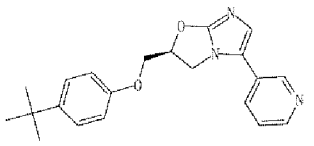
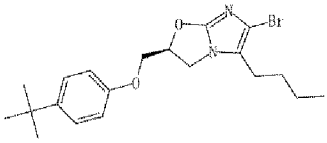
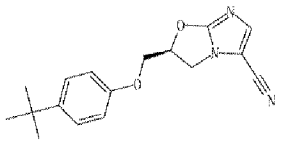
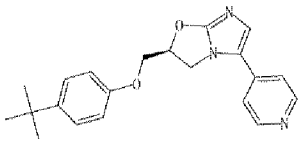
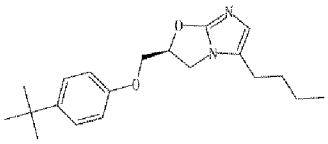
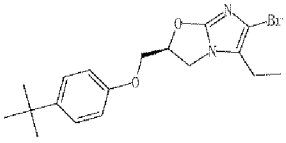
[0191]

[表2-2]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
7		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 4.26 - 4.38 (m, 4 H), 5.56 - 5.61 (m, 1 H), 6.80 - 6.83 (m, 2 H), 7.22 (s, 1 H), 7.30 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 298 [M+H]+	5
8		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-クロロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.15 - 4.19 (m, 1 H), 4.23 - 4.30 (m, 3 H), 5.45 - 5.50 (m, 1 H), 6.53 (s, 1 H), 6.81 - 6.85 (m, 2 H), 7.30 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 307 [M+H]+	2
9		(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-クロロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.17 - 4.21 (m, 1 H), 4.25 - 4.29 (m, 3 H), 5.50 - 5.55 (m, 1 H), 6.82 - 6.85 (m, 2 H), 7.30 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 385 [M+H]+	2
10		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-クロロ-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 2.13 (s, 3 H), 4.06 - 4.11 (m, 1 H), 4.16 - 4.31 (m, 3 H), 5.43 - 5.49 (m, 1 H), 6.81 - 6.86 (m, 2 H), 7.30 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 321 [M+H]+	3
11		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 2.34 (s, 3 H), 4.15 - 4.20 (m, 1 H), 4.22 - 4.27 (m, 1 H), 4.27 - 4.30 (m, 2 H), 5.54 - 5.60 (m, 1 H), 6.80 - 6.85 (m, 2 H), 7.30 - 7.34 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 312 [M+H]+	5
12		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(トリメチルシリル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.25 (s, 9 H), 1.29 (s, 9 H), 4.06 - 4.11 (m, 1 H), 4.22 - 4.27 (m, 2 H), 4.29 - 4.33 (m, 1 H), 5.50 - 5.56 (m, 1 H), 6.75 (s, 1 H), 6.83 - 6.87 (m, 2 H), 7.30 - 7.34 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 345 [M+H]+	8

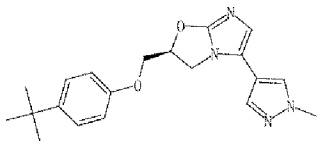
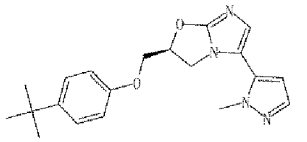
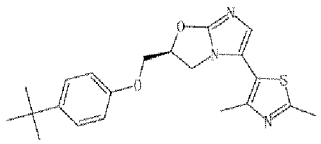
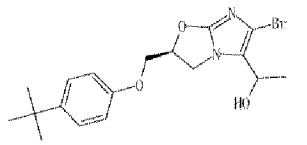
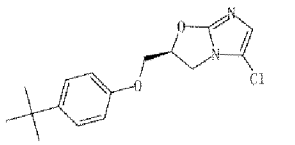
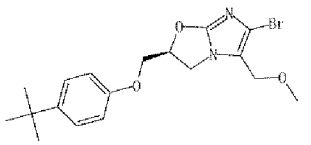
[0192]

[表2-3]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
13		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.30 - 4.37 (m, 2 H), 4.39 - 4.43 (m, 1 H), 4.50 - 4.54 (m, 1 H), 5.60 - 5.66 (m, 1 H), 6.84 - 6.87 (m, 2 H), 7.01 (s, 1 H), 7.29 - 7.34 (m, 3 H), 7.69 - 7.71 (m, 1 H), 8.47 - 8.49 (m, 1 H), 8.69 - 8.71 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 350 [M+H]+	4
14		(2S)-6-ブロモ-5-ブチル-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.90 - 0.98 (m, 3 H), 1.30 (s, 9 H), 1.32 - 1.40 (m, 2 H), 1.48 - 1.57 (m, 2 H), 2.46 - 2.54 (m, 2 H), 4.07 - 4.12 (m, 1 H), 4.18 - 4.30 (m, 3 H), 5.44 - 5.50 (m, 1 H), 6.81 - 6.85 (m, 2 H), 7.28 - 7.34 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 407 [M+H]+	3
15		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.27 - 4.32 (m, 1 H), 4.33 - 4.37 (m, 2 H), 4.39 - 4.44 (m, 1 H), 5.64 - 5.69 (m, 1 H), 6.81 - 6.85 (m, 2 H), 7.30 - 7.34 (m, 2 H), 7.37 (s, 1 H); ESI/APCI MS m/z 298 [M+H]+	5
16		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-4-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 4.31 - 4.37 (m, 2 H), 4.44 - 4.50 (m, 1 H), 4.55 - 4.60 (m, 1 H), 5.62 - 5.67 (m, 1 H), 6.83 - 6.87 (m, 2 H), 7.19 (s, 1 H), 7.24 - 7.27 (m, 2 H), 7.30 - 7.34 (m, 2 H), 8.54 - 8.57 (m, 2 H)	4
17		(2S)-5-ブチル-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.91 - 0.95 (m, 3 H), 1.30 (s, 9 H), 1.35 - 1.42 (m, 2 H), 1.51 - 1.58 (m, 2 H), 2.44 - 2.49 (m, 2 H), 4.02 - 4.07 (m, 1 H), 4.16 - 4.24 (m, 2 H), 4.27 - 4.32 (m, 1 H), 5.46 - 5.52 (m, 1 H), 6.33 (s, 1 H), 6.82 - 6.86 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 329 [M+H]+	6
18		(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.15 - 1.19 (m, 3 H), 1.30 (s, 9 H), 2.51 - 2.56 (m, 2 H), 4.09 - 4.14 (m, 1 H), 4.20 - 4.30 (m, 3 H), 5.45 - 5.50 (m, 1 H), 6.82 - 6.85 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 379 [M+H]+	3

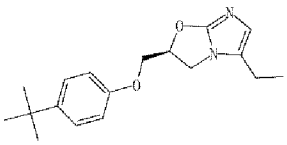
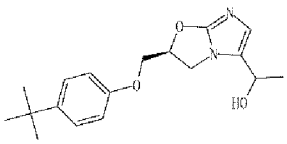
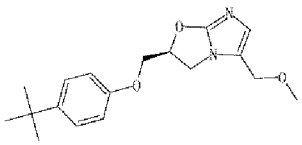
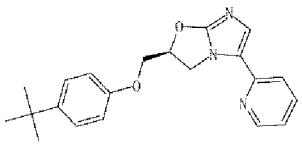
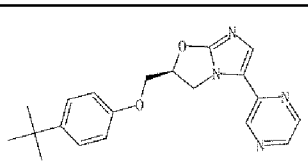
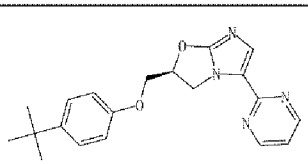
[0193]

[表2-4]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
19		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (500 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 3.92 (s, 3 H), 4.19 - 4.37 (m, 4 H), 5.53 - 5.61 (m, 1 H), 6.67 (s, 1 H), 6.81 - 6.88 (m, 2 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H), 7.43 (s, 1 H), 7.53 (s, 1 H); ESI/APCI MS m/z 353 [M+H]+	4
20		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (499 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 3.97 (s, 3 H), 4.21 - 4.38 (m, 4 H), 5.58 - 5.65 (m, 1 H), 6.23 (s, 1 H), 6.81 - 6.87 (m, 3 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H), 7.48 - 7.50 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 353 [M+H]+	4
21		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(2,4-ジメチル-1,3-チアゾール-5-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (500 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 2.45 (s, 3 H), 2.67 (s, 3 H), 4.14 - 4.19 (m, 1 H), 4.25 - 4.35 (m, 3 H), 5.54 - 5.61 (m, 1 H), 6.75 (s, 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 2 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 384 [M+H]+	4
22		1-{(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-イル}エタノール	1H NMR (499 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 1.49 (d, J=6.5 Hz, 3 H), 1.93 (br. s, 1 H), 4.21 - 4.39 (m, 4 H), 4.95 - 5.02 (m, 1 H), 5.46 - 5.53 (m, 1 H), 6.81 - 6.86 (m, 2 H), 7.28 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 395 [M+H]+	3
23		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-クロロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (499 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.13 - 4.18 (m, 1 H), 4.23 - 4.33 (m, 3 H), 5.51 - 5.57 (m, 1 H), 6.52 (s, 1 H), 6.83 - 6.87 (m, 2 H), 7.30 - 7.34 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 307 [M+H]+	7
24		(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(メトキシメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 3.33 (s, 3 H), 4.15 - 4.19 (m, 1 H), 4.23 - 4.31 (m, 3 H), 4.34 (s, 2 H), 5.48 - 5.54 (m, 1 H), 6.81 - 6.85 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 395 [M+H]+	3

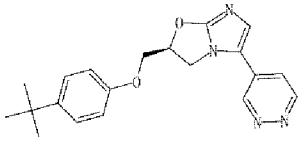
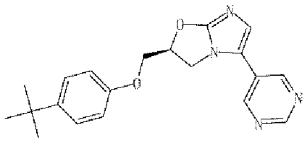
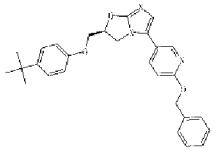
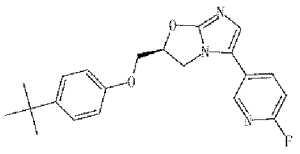
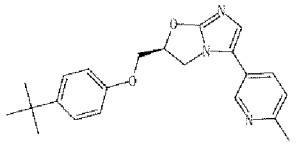
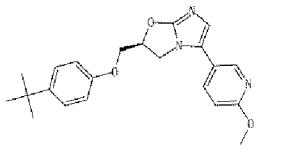
[0194]

[表2-5]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
25		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.18 - 1.23 (m, 3 H), 1.30 (s, 9 H), 2.48 - 2.53 (m, 2 H), 4.03 - 4.07 (m, 1 H), 4.17 - 4.24 (m, 2 H), 4.27 - 4.32 (m, 1 H), 5.46 - 5.52 (m, 1 H), 6.33 (s, 1 H), 6.82 - 6.86 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 301 [M+H]+	6
26		1-{(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-イル}エタノール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 1.54 (d, J=6.6 Hz, 3 H), 4.19 - 4.26 (m, 2 H), 4.28 - 4.32 (m, 1 H), 4.35 - 4.39 (m, 1 H), 4.79 - 4.83 (m, 1 H), 5.51 - 5.56 (m, 1 H), 6.51 (s, 1 H), 6.82 - 6.86 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 317 [M+H]+	6
27		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(メトキシメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 3.31 (s, 3 H), 4.10 - 4.15 (m, 1 H), 4.21 - 4.33 (m, 5 H), 5.50 - 5.56 (m, 1 H), 6.61 (s, 1 H), 6.82 - 6.86 (m, 2 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 317 [M+H]+	6
28		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-2-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 4.26 - 4.36 (m, 2 H), 4.54 - 4.58 (m, 1 H), 4.71 - 4.76 (m, 1 H), 5.56 - 5.64 (m, 1 H), 6.84 - 6.89 (m, 2 H), 7.02 - 7.07 (m, 1 H), 7.17 (s, 1 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H), 7.48 (s, 1 H), 7.58 - 7.64 (m, 1 H), 8.43 - 8.49 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 350 [M+H]+	4
29		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(ピラジン-2-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 4.29 - 4.35 (m, 2 H), 4.53 - 4.57 (m, 1 H), 4.67 - 4.72 (m, 1 H), 5.60 - 5.66 (m, 1 H), 6.84 - 6.88 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 3 H), 8.28 - 8.30 (m, 1 H), 8.37 - 8.39 (m, 1 H), 8.79 - 8.82 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 351 [M+H]+	4
30		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(ピリミジン-2-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 4.28 - 4.37 (m, 2 H), 4.54 - 4.58 (m, 1 H), 4.68 - 4.73 (m, 1 H), 5.59 - 5.66 (m, 1 H), 6.84 - 6.89 (m, 2 H), 6.98 - 7.02 (m, 1 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H), 7.59 (s, 1 H), 8.59 - 8.63 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 351 [M+H]+	4

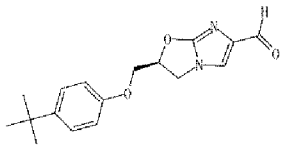
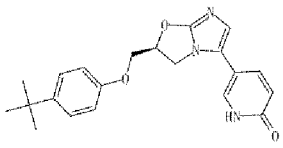
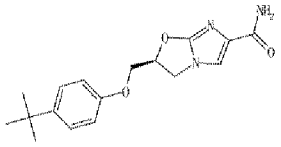
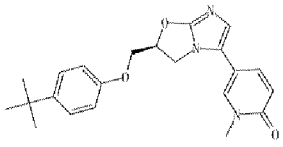
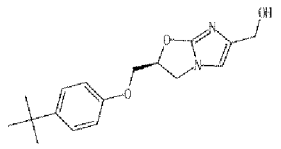
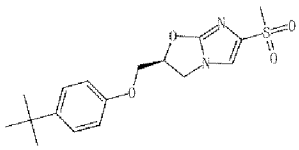
[0195]

[表2-6]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
31		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(ピリダジン-4-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 4.36 (s, 2 H), 4.51 - 4.56 (m, 1 H), 4.59 - 4.65 (m, 1 H), 5.66 - 5.73 (m, 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 2 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H), 7.37 (br. s., 2 H), 9.12 (br. s., 1 H), 9.30 (br. s., 1 H); ESI/APCI MS m/z 351 [M+H]+	4
32		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(ピリミジン-5-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 4.32 - 4.38 (m, 2 H), 4.42 - 4.46 (m, 1 H), 4.51 - 4.56 (m, 1 H), 5.63 - 5.69 (m, 1 H), 6.83 - 6.87 (m, 2 H), 7.11 (s, 1 H), 7.30 - 7.34 (m, 2 H), 8.80 (s, 2 H), 9.07 (s, 1 H); ESI/APCI MS m/z 351 [M+H]+	4
33		(2S)-5-[6-(ベンジルオキシ)ピリジン-3-イル]-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.27 - 4.31 (m, 1 H), 4.32 - 4.37 (m, 2 H), 4.43 - 4.48 (m, 1 H), 5.39 (s, 2 H), 5.57 - 5.64 (m, 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 4 H), 7.30 - 7.34 (m, 3 H), 7.36 - 7.41 (m, 2 H), 7.44 - 7.48 (m, 2 H), 7.63 - 7.66 (m, 1 H), 8.20 - 8.23 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 456 [M+H]+	4
34		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(6-フルオロピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 4.27 - 4.41 (m, 3 H), 4.44 - 4.53 (m, 1 H), 5.59 - 5.68 (m, 1 H), 6.80 - 6.89 (m, 2 H), 6.91 - 7.01 (m, 2 H), 7.28 - 7.36 (m, 2 H), 7.77 - 7.86 (m, 1 H), 8.25 (s, 1 H); ESI/APCI MS m/z 368 [M+H]+	4
35		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(6-メチルピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 2.56 (s, 3 H), 4.28 - 4.39 (m, 3 H), 4.46 - 4.51 (m, 1 H), 5.58 - 5.64 (m, 1 H), 6.83 - 6.87 (m, 2 H), 6.95 (s, 1 H), 7.14 - 7.18 (m, 1 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H), 7.58 - 7.62 (m, 1 H), 8.54 - 8.58 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 364 [M+H]+	4
36		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(6-メトキシピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 3.95 (s, 3 H), 4.27 - 4.36 (m, 3 H), 4.42 - 4.47 (m, 1 H), 5.58 - 5.64 (m, 1 H), 6.76 - 6.80 (m, 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 3 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H), 7.60 - 7.64 (m, 1 H), 8.19 - 8.22 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 380 [M+H]+	4

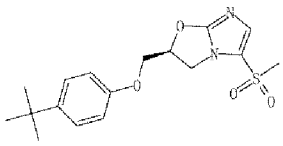
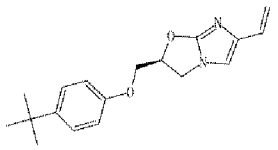
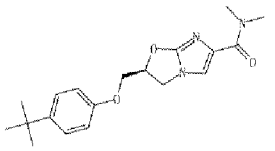
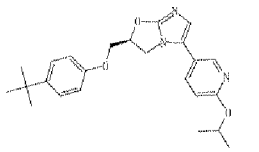
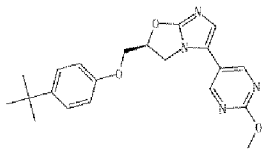
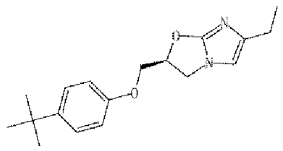
[0196]

[表2-7]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
37		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルバルデヒド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 4.29 - 4.41 (m, 4 H), 5.56 - 5.61 (m, 1 H), 6.80 - 6.84 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H), 7.38 (s, 1 H), 9.68 (s, 1 H); ESI/APCI MS m/z 301 [M+H]+	23
38		5-{(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-イル}ピリジン-2(1H)-オン	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.24 - 4.41 (m, 4 H), 5.56 - 5.63 (m, 1 H), 6.62 - 6.68 (m, 1 H), 6.76 (s, 1 H), 6.82 - 6.88 (m, 2 H), 7.29 - 7.35 (m, 2 H), 7.37 - 7.40 (m, 1 H), 7.57 - 7.62 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 366 [M+H]+	34
39		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ ppm 1.25 (s, 9 H), 4.05 - 4.11 (m, 1 H), 4.25 - 4.40 (m, 3 H), 5.61 - 5.66 (m, 1 H), 6.85 - 6.90 (m, 2 H), 6.96 (br. s., 1 H), 7.07 (br. s., 1 H), 7.28 - 7.32 (m, 2 H), 7.35 (s, 1 H); ESI/APCI MS m/z 316 [M+H]+	16
40		5-{(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-イル}-1-メチルピリジン-2(1H)-オン	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 3.58 (s, 3 H), 4.23 - 4.38 (m, 4 H), 5.56 - 5.62 (m, 1 H), 6.64 (d, J=9.5 Hz, 1 H), 6.70 (s, 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 2 H), 7.29 - 7.34 (m, 3 H), 7.40 (dd, J=9.5, 2.5 Hz, 1 H); ESI/APCI MS m/z 380 [M+H]+	4
41		[(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-イル]メタノール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.13 - 4.17 (m, 1 H), 4.22 - 4.31 (m, 3 H), 4.48 (s, 2 H), 5.48 - 5.53 (m, 1 H), 6.57 (s, 1 H), 6.81 - 6.87 (m, 2 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 303 [M+H]+	24
42		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-(メチルスルホニル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 3.13 (s, 3 H), 4.27 - 4.40 (m, 4 H), 5.57 - 5.63 (m, 1 H), 6.81 - 6.85 (m, 2 H), 7.30 - 7.34 (m, 3 H); ESI/APCI MS m/z 351 [M+H]+	22

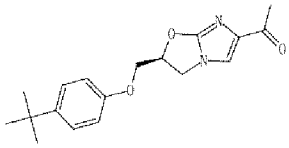
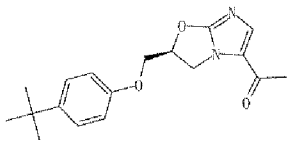
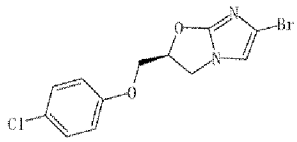
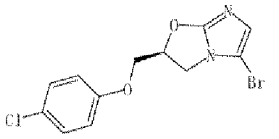
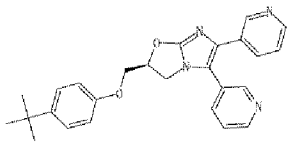
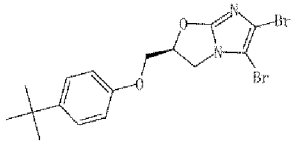
[0197]

[表2-8]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
43		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(メチルスルホニル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 3.14 (s, 3 H), 4.28 - 4.51 (m, 4 H), 5.63 - 5.69 (m, 1 H), 6.81 - 6.84 (m, 2 H), 7.30 - 7.34 (m, 2 H), 7.36 (s, 1 H); ESI/APCI MS m/z 351 [M+H]+	22
44		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-エテニル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 4.12 - 4.16 (m, 1 H), 4.21 - 4.31 (m, 3 H), 5.04 - 5.07 (m, 1 H), 5.46 - 5.52 (m, 1 H), 5.74 - 5.79 (m, 1 H), 6.41 - 6.49 (m, 1 H), 6.54 (s, 1 H), 6.81 - 6.86 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 299 [M+H]+	26
45		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-N,N-ジメチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 3.05 (br. s., 3 H), 3.44 (br. s., 3 H), 4.21 - 4.35 (m, 4 H), 5.50 - 5.55 (m, 1 H), 6.81 - 6.84 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 3 H); ESI/APCI MS m/z 344 [M+H]+	19
46		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-[6-(プロパン-2-イルオキシ)ピリジン-3-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 1.33 - 1.38 (m, 6 H), 4.26 - 4.36 (m, 3 H), 4.41 - 4.46 (m, 1 H), 5.25 - 5.33 (m, 1 H), 5.55 - 5.62 (m, 1 H), 6.69 - 6.72 (m, 1 H), 6.80 - 6.87 (m, 3 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H), 7.58 - 7.62 (m, 1 H), 8.17 - 8.20 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 408 [M+H]+	4
47		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(2-メトキシピリミジン-5-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 4.04 (s, 3 H), 4.29 - 4.37 (m, 3 H), 4.40 - 4.47 (m, 1 H), 5.58 - 5.66 (m, 1 H), 6.81 - 6.88 (m, 2 H), 6.92 (s, 1 H), 7.29 - 7.35 (m, 2 H), 8.57 (s, 2 H); ESI/APCI MS m/z 381 [M+H]+	4
48		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.19 (t, J=7.4 Hz, 3 H), 1.29 (s, 9 H), 2.51 (q, J=7.4 Hz, 2 H), 4.05 - 4.10 (m, 1 H), 4.18 - 4.22 (m, 2 H), 4.27 - 4.31 (m, 1 H), 5.41 - 5.47 (m, 1 H), 6.30 (s, 1 H), 6.82 - 6.86 (m, 2 H), 7.29 - 7.32 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 301 [M+H]+	27

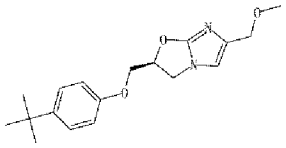
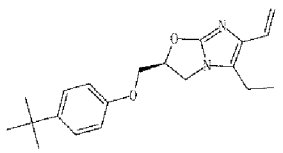
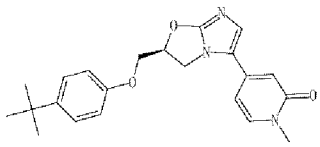
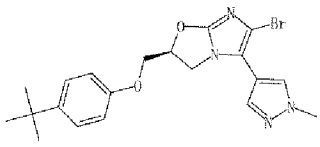
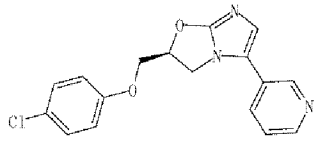
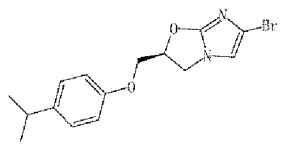
[0198]

[表2-9]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
49		1-{(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-イル}エタノン	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 2.47 (s, 3 H), 4.26 - 4.30 (m, 3 H), 4.33 - 4.38 (m, 1 H), 5.53 - 5.58 (m, 1 H), 6.81 - 6.84 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H), 7.34 (s, 1 H); ESI/APCI MS m/z 315 [M+H]+	21
50		1-{(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-イル}エタノン	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 2.37 (s, 3 H), 4.26 - 4.32 (m, 2 H), 4.41 - 4.45 (m, 1 H), 4.52 - 4.57 (m, 1 H), 5.61 - 5.66 (m, 1 H), 6.81 - 6.85 (m, 2 H), 7.29 - 7.32 (m, 2 H), 7.42 (s, 1 H); ESI/APCI MS m/z 315 [M+H]+	21
51		(2S)-6-ブロモ-2-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.15 - 4.21 (m, 1 H), 4.22 - 4.32 (m, 3 H), 5.45 - 5.53 (m, 1 H), 6.62 (s, 1 H), 6.78 - 6.86 (m, 2 H), 7.21 - 7.29 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 329 [M+H]+	1
52		(2S)-5-ブロモ-2-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.09 - 4.16 (m, 1 H), 4.21 - 4.32 (m, 3 H), 5.51 - 5.58 (m, 1 H), 6.60 (s, 1 H), 6.80 - 6.87 (m, 2 H), 7.21 - 7.30 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 329 [M+H]+	1
53		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5,6-ジ(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 4.23 - 4.27 (m, 1 H), 4.33 - 4.38 (m, 3 H), 5.60 - 5.66 (m, 1 H), 6.84 - 6.88 (m, 2 H), 7.20 - 7.24 (m, 1 H), 7.29 - 7.34 (m, 3 H), 7.64 - 7.68 (m, 1 H), 7.85 - 7.88 (m, 1 H), 8.44 - 8.46 (m, 1 H), 8.57 - 8.60 (m, 1 H), 8.63 - 8.66 (m, 1 H), 8.70 - 8.73 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 427 [M+H]+	4
54		(2S)-5,6-ジブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.15 - 4.32 (m, 4 H), 5.49 - 5.56 (m, 1 H), 6.81 - 6.87 (m, 2 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 429 [M+H]+	1

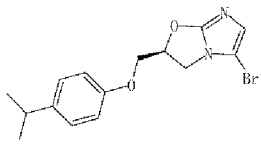
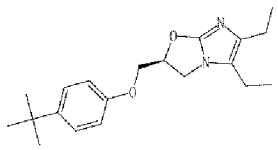
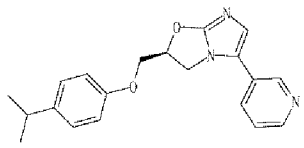
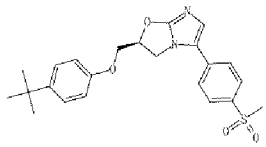
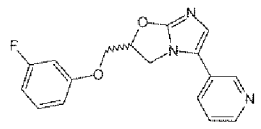
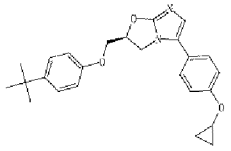
[0199]

[表2-10]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
55		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-(メトキシメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 3.41 (s, 3 H), 4.10 - 4.31 (m, 6 H), 5.45 - 5.51 (m, 1 H), 6.59 (s, 1 H), 6.81 - 6.85 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 317 [M+H]+	25
56		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-エテニル-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.17 (t, J=7.8 Hz, 3 H), 1.29 (s, 9 H), 2.58 (q, J=7.8 Hz, 2 H), 4.05 - 4.10 (m, 1 H), 4.17 - 4.24 (m, 2 H), 4.27 - 4.30 (m, 1 H), 4.98 - 5.02 (m, 1 H), 5.45 - 5.50 (m, 1 H), 5.67 - 5.72 (m, 1 H), 6.46 - 6.53 (m, 1 H), 6.82 - 6.85 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 327 [M+H]+	28
57		4-{(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-イル}-1-メチルピリジン-2(1H)-オン	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 3.54 (s, 3 H), 4.28 - 4.35 (m, 2 H), 4.43 - 4.47 (m, 1 H), 4.53 - 4.58 (m, 1 H), 5.62 - 5.68 (m, 1 H), 6.33 (dd, J=7.4, 2.1 Hz, 1 H), 6.47 (d, J=2.1 Hz, 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 2 H), 7.14 (s, 1 H), 7.24 (d, J=7.4 Hz, 1 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 380 [M+H]+	4
58		(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 3.95 (s, 3 H), 4.26 - 4.33 (m, 3 H), 4.36 - 4.41 (m, 1 H), 5.51 - 5.59 (m, 1 H), 6.81 - 6.88 (m, 2 H), 7.29 - 7.35 (m, 2 H), 7.64 (s, 1 H), 7.76 (s, 1 H); ESI/APCI MS m/z 431 [M+H]+	4
59		(2S)-2-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.31 - 4.34 (m, 2 H), 4.39 - 4.43 (m, 1 H), 4.51 - 4.56 (m, 1 H), 5.61 - 5.66 (m, 1 H), 6.83 - 6.87 (m, 2 H), 7.01 (s, 1 H), 7.24 - 7.28 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 1 H), 7.69 - 7.72 (m, 1 H), 8.47 - 8.50 (m, 1 H), 8.68 - 8.71 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 328 [M+H]+	4
60		(2S)-6-ブロモ-2-{[4-(プロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.22 (d, J=7.0 Hz, 6 H), 2.82 - 2.90 (m, 1 H), 4.16 - 4.20 (m, 1 H), 4.21 - 4.29 (m, 3 H), 5.46 - 5.51 (m, 1 H), 6.61 (s, 1 H), 6.83 (d, J=8.7 Hz, 2 H), 7.15 (d, J=8.7 Hz, 2 H); ESI/APCI MS m/z 337 [M+H]+	1

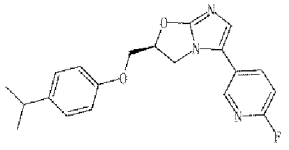
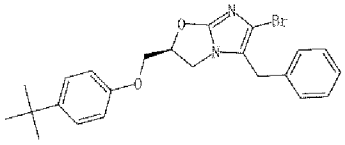
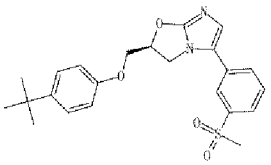
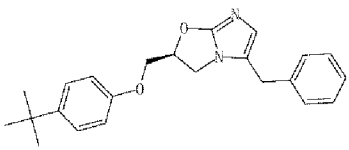
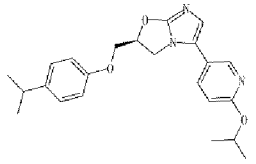
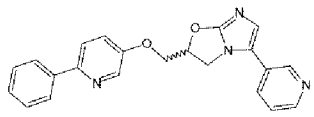
[0200]

[表2-11]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
61		(2S)-5-ブロモ-2-{[4-(プロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.22 (d, J=6.6 Hz, 6 H), 2.82 - 2.92 (m, 1 H), 4.09 - 4.32 (m, 4 H), 5.51 - 5.57 (m, 1 H), 6.59 (s, 1 H), 6.80 - 6.87 (m, 2 H), 7.12 - 7.19 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 337 [M+H]+	1
62		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5,6-ジエチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.13 (t, J=7.6 Hz, 3 H), 1.17 (t, J=7.4 Hz, 3 H), 1.30 (s, 9 H), 2.41 (q, J=7.4 Hz, 2 H), 2.48 (q, J=7.6 Hz, 2 H), 4.00 - 4.03 (m, 1 H), 4.14 - 4.22 (m, 2 H), 4.28 - 4.32 (m, 1 H), 5.41 - 5.47 (m, 1 H), 6.83 - 6.86 (m, 2 H), 7.30 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 329 [M+H]+	29
63		(2S)-2-{[4-(プロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.22 (d, J=7.0 Hz, 6 H), 2.86 (dt, J=13.7, 7.0 Hz, 1 H), 4.28 - 4.37 (m, 2 H), 4.38 - 4.43 (m, 1 H), 4.49 - 4.55 (m, 1 H), 5.59 - 5.66 (m, 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 2 H), 7.01 (s, 1 H), 7.13 - 7.18 (m, 2 H), 7.27 - 7.32 (m, 1 H), 7.68 - 7.72 (m, 1 H), 8.46 - 8.50 (m, 1 H), 8.68 - 8.72 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 336 [M+H]+	4
64		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-[4-(メチルスルホニル)フェニル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 3.06 (s, 3 H), 4.31 - 4.37 (m, 2 H), 4.42 - 4.48 (m, 1 H), 4.53 - 4.58 (m, 1 H), 5.62 - 5.68 (m, 1 H), 6.83 - 6.87 (m, 2 H), 7.13 (s, 1 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H), 7.53 - 7.58 (m, 2 H), 7.90 - 7.94 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 427 [M+H]+	4
65		2-[(3-フルオロフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.33 - 4.36 (m, 2 H), 4.39 - 4.43 (m, 1 H), 4.52 - 4.57 (m, 1 H), 5.62 - 5.67 (m, 1 H), 6.62 - 6.66 (m, 1 H), 6.69 - 6.75 (m, 2 H), 7.02 (s, 1 H), 7.22 - 7.33 (m, 2 H), 7.69 - 7.73 (m, 1 H), 8.47 - 8.51 (m, 1 H), 8.68 - 8.71 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 312 [M+H]+	9
66		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-[4-(シクロプロピルオキシ)フェニル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.74 - 0.83 (m, 4 H), 1.30 (s, 9 H), 3.71 - 3.77 (m, 1 H), 4.24 - 4.36 (m, 3 H), 4.42 - 4.48 (m, 1 H), 5.54 - 5.61 (m, 1 H), 6.80 (s, 1 H), 6.82 - 6.88 (m, 2 H), 7.03 - 7.08 (m, 2 H), 7.27 - 7.34 (m, 4 H); ESI/APCI MS m/z 405 [M+H]+	4

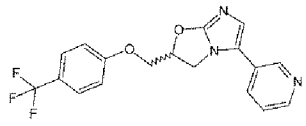
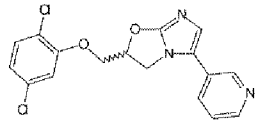
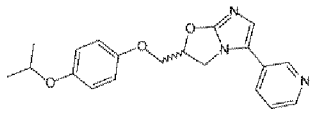
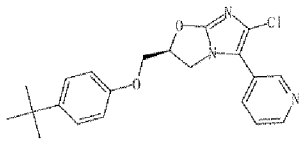
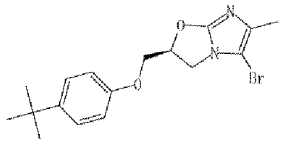
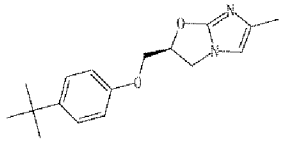
[0201]

[表2-12]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
67		(2S)-5-(6-フルオロピリジン-3-イル)-2-{[4-(プロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.22 (d, J=6.6 Hz, 6 H), 2.80 - 2.91 (m, 1 H), 4.25 - 4.40 (m, 3 H), 4.43 - 4.51 (m, 1 H), 5.58 - 5.67 (m, 1 H), 6.80 - 6.87 (m, 2 H), 6.91 - 7.00 (m, 2 H), 7.11 - 7.18 (m, 2 H), 7.81 (td, J=7.8, 2.5 Hz, 1 H), 8.25 (d, J=2.5 Hz, 1 H); ESI/APCI MS m/z 354 [M+H]+	4
68		(2S)-5-ベンジル-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 3.71 - 3.93 (m, 4 H), 4.15 (d, J=5.0 Hz, 2 H), 5.32 - 5.37 (m, 1 H), 6.75 - 6.79 (m, 2 H), 7.18 - 7.33 (m, 7 H); ESI/APCI MS m/z 441 [M+H]+	3
69		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-[3-(メチルスルホニル)フェニル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 3.08 (s, 3 H), 4.30 - 4.37 (m, 2 H), 4.40 - 4.46 (m, 1 H), 4.54 - 4.60 (m, 1 H), 5.59 - 5.68 (m, 1 H), 6.82 - 6.88 (m, 2 H), 7.07 (s, 1 H), 7.28 - 7.35 (m, 2 H), 7.54 - 7.60 (m, 1 H), 7.65 - 7.70 (m, 1 H), 7.75 - 7.80 (m, 1 H), 7.90 - 7.94 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 427 [M+H]+	4
70		(2S)-5-ベンジル-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 3.70 - 3.74 (m, 1 H), 3.78 - 3.89 (m, 3 H), 4.13 - 4.21 (m, 2 H), 5.35 - 5.40 (m, 1 H), 6.47 (s, 1 H), 6.77 - 6.82 (m, 2 H), 7.18 - 7.33 (m, 7 H); ESI/APCI MS m/z 363 [M+H]+	6
71		(2S)-5-[6-(プロパン-2-イルオキシ)ピリジン-3-イル]-2-{[4-(プロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.22 (d, J=7.0 Hz, 6 H), 1.36 (d, J=6.2 Hz, 6 H), 2.81 - 2.91 (m, 1 H), 4.25 - 4.37 (m, 3 H), 4.39 - 4.47 (m, 1 H), 5.24 - 5.34 (m, 1 H), 5.55 - 5.63 (m, 1 H), 6.67 - 6.74 (m, 1 H), 6.80 - 6.88 (m, 3 H), 7.10 - 7.20 (m, 2 H), 7.57 - 7.63 (m, 1 H), 8.15 - 8.21 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 394 [M+H]+	4
72		2-{[(6-フェニルピリジン-3-イル)オキシ]メチル}-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.43 - 4.49 (m, 3 H), 4.56 - 4.61 (m, 1 H), 5.67 - 5.72 (m, 1 H), 7.03 (s, 1 H), 7.30 - 7.34 (m, 2 H), 7.36 - 7.40 (m, 1 H), 7.43 - 7.48 (m, 2 H), 7.67 - 7.74 (m, 2 H), 7.91 - 7.94 (m, 2 H), 8.40 - 8.42 (m, 1 H), 8.48 - 8.51 (m, 1 H), 8.70 - 8.73 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 371 [M+H]+	9

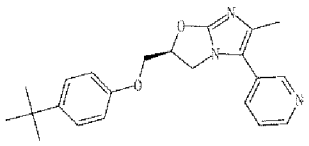
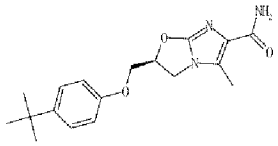
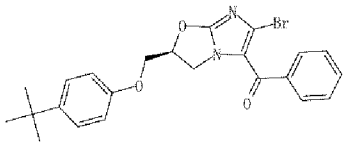
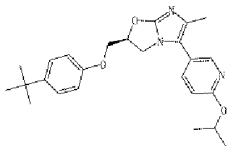
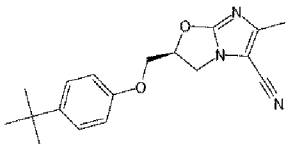
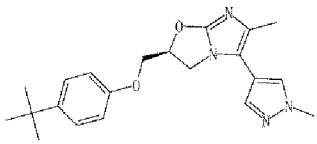
[0202]

[表2-13]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
73		5-(ピリジン-3-イル)-2-{[4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.38 - 4.45 (m, 3 H), 4.52 - 4.61 (m, 1 H), 5.64 - 5.70 (m, 1 H), 6.97 - 7.04 (m, 3 H), 7.29 - 7.34 (m, 1 H), 7.55 - 7.59 (m, 2 H), 7.69 - 7.73 (m, 1 H), 8.48 - 8.51 (m, 1 H), 8.68 - 8.71 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 362 [M+H]+	9
74		2-[(2,5-ジクロロフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.35 - 4.39 (m, 1 H), 4.41 - 4.45 (m, 1 H), 4.49 - 4.58 (m, 2 H), 5.64 - 5.69 (m, 1 H), 6.94 - 6.98 (m, 2 H), 7.00 (s, 1 H), 7.26 - 7.33 (m, 2 H), 7.70 - 7.73 (m, 1 H), 8.48 - 8.51 (m, 1 H), 8.70 - 8.72 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 362 [M+H]+	9
75		2-{[4-(プロパン-2-イルオキシ)フェノキシ]メチル}-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (d, J=6.2 Hz, 6 H), 4.27 - 4.33 (m, 2 H), 4.39 - 4.45 (m, 2 H), 4.50 - 4.54 (m, 1 H), 5.59 - 5.64 (m, 1 H), 6.81 - 6.85 (m, 4 H), 7.01 (s, 1 H), 7.28 - 7.32 (m, 1 H), 7.69 - 7.72 (m, 1 H), 8.46 - 8.49 (m, 1 H), 8.68 - 8.71 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 352 [M+H]+	9
76		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-クロロ-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.28 - 1.31 (m, 9 H), 4.31 - 4.38 (m, 3 H), 4.43 - 4.48 (m, 1 H), 5.55 - 5.61 (m, 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 2 H), 7.30 - 7.34 (m, 2 H), 7.35 - 7.39 (m, 1 H), 7.92 - 7.97 (m, 1 H), 8.51 - 8.55 (m, 1 H), 8.75 - 8.78 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 384 [M+H]+	31
77		(2S)-5-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 2.09 (s, 3 H), 4.04 - 4.09 (m, 1 H), 4.15 - 4.30 (m, 3 H), 5.44 - 5.51 (m, 1 H), 6.81 - 6.86 (m, 2 H), 7.27 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 365 [M+H]+	1
78		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 2.14 (s, 3 H), 4.03 - 4.10 (m, 1 H), 4.16 - 4.23 (m, 2 H), 4.26 - 4.31 (m, 1 H), 5.40 - 5.49 (m, 1 H), 6.30 (s, 1 H), 6.79 - 6.87 (m, 2 H), 7.27 - 7.34 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 287 [M+H]+	6

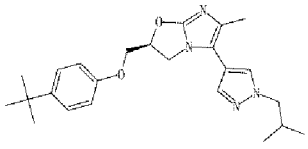
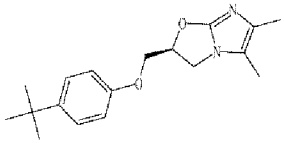
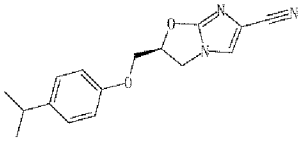
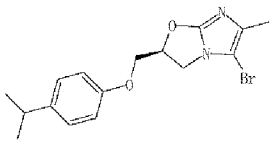
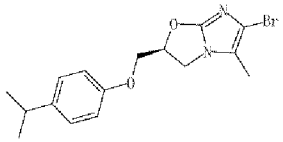
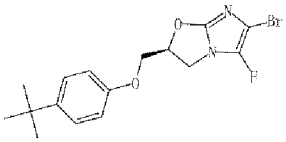
[0203]

[表2-14]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
79		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-メチル-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 2.32 (s, 3 H), 4.18 - 4.37 (m, 4 H), 5.51 - 5.59 (m, 1 H), 6.82 - 6.88 (m, 2 H), 7.29 - 7.36 (m, 3 H), 7.61 - 7.66 (m, 1 H), 8.47 - 8.52 (m, 1 H), 8.61 - 8.65 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 364 [M+H]+	4
80		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ ppm 1.25 (s, 9 H), 2.39 (s, 3 H), 4.00 - 4.05 (m, 1 H), 4.25 - 4.34 (m, 3 H), 5.60 - 5.65 (m, 1 H), 6.80 (br. s., 1 H), 6.86 - 6.91 (m, 3 H), 7.28 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 330 [M+H]+	16
81		[(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-イル](フェニル)メタノン	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.29 - 4.38 (m, 2 H), 4.49 - 4.53 (m, 1 H), 4.60 - 4.65 (m, 1 H), 5.63 - 5.68 (m, 1 H), 6.84 - 6.88 (m, 2 H), 7.30 - 7.34 (m, 2 H), 7.45 - 7.50 (m, 2 H), 7.56 - 7.60 (m, 1 H), 7.74 - 7.78 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 455 [M+H]+	3
82		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-メチル-5-[6-(プロパン-2-イルオキシ)ピリジン-3-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 1.37 (d, J=6.2 Hz, 6 H), 2.25 (s, 3 H), 4.10 - 4.17 (m, 1 H), 4.22 - 4.34 (m, 3 H), 5.25 - 5.34 (m, 1 H), 5.48 - 5.55 (m, 1 H), 6.70 - 6.76 (m, 1 H), 6.81 - 6.87 (m, 2 H), 7.28 - 7.33 (m, 2 H), 7.50 - 7.54 (m, 1 H), 8.11 - 8.14 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 422 [M+H]+	4
83		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 2.32 (s, 3 H), 4.24 - 4.38 (m, 4 H), 5.55 - 5.64 (m, 1 H), 6.81 - 6.85 (m, 2 H), 7.29 - 7.36 (m, 2 H); ESI MS m/z 312 [M+H]+	5
84		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-メチル-5-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 2.23 (s, 3 H), 3.94 (s, 3 H), 4.10 - 4.34 (m, 4 H), 5.48 - 5.54 (m, 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H), 7.39 (s, 1 H), 7.50 (s, 1 H); ESI/APCI MS m/z 367 [M+H]+	4

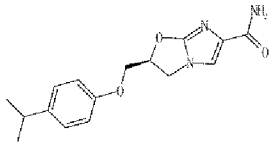
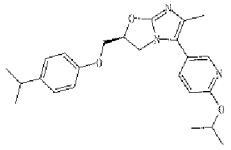
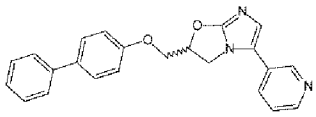
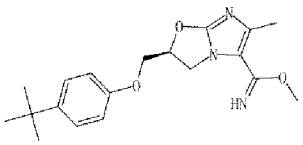
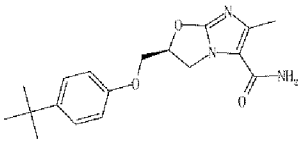
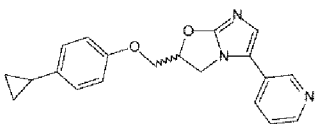
[0204]

[表2-15]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
85		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-メチル-5-[1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.94 (d, J=6.6 Hz, 6 H), 1.29 (s, 9 H), 2.18 - 2.27 (m, 4 H), 3.91 - 3.96 (m, 2 H), 4.14 - 4.18 (m, 1 H), 4.22 - 4.35 (m, 3 H), 5.48 - 5.55 (m, 1 H), 6.85 (d, J=8.7 Hz, 2 H), 7.31 (d, J=8.7 Hz, 2 H), 7.38 (s, 1 H), 7.52 (s, 1 H) ; ESI/APCI MS m/z 409 [M+H]+	4
86		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5,6-ジメチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 2.06 (s, 3 H), 2.06 (s, 3 H), 3.96 - 4.01 (m, 1 H), 4.09 - 4.33 (m, 3 H), 5.41 - 5.47 (m, 1 H), 6.81 - 6.86 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 301 [M+H]+	4
87		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-メチル-5-[1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.22 (d, J=7.0 Hz, 6 H), 2.82 - 2.91 (m, 1 H), 4.25 - 4.38 (m, 4 H), 5.55 - 5.62 (m, 1 H), 6.78 - 6.84 (m, 2 H), 7.12 - 7.18 (m, 2 H), 7.22 (s, 1 H); ESI MS m/z 284 [M+H]+	5
88		(2S)-5-ブロモ-6-メチル-2-{[4-(プロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.22 (d, J=7.0 Hz, 6 H), 2.09 (s, 3 H), 2.81 - 2.90 (m, 1 H), 4.03 - 4.30 (m, 4 H), 5.42 - 5.50 (m, 1 H), 6.79 - 6.87 (m, 2 H), 7.10 - 7.18 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 351 [M+H]+	1
89		(2S)-6-ブロモ-5-メチル-2-{[4-(プロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.22 (d, J=7.0 Hz, 6 H), 2.10 (s, 3 H), 2.82 - 2.90 (m, 1 H), 4.04 - 4.10 (m, 1 H), 4.15 - 4.27 (m, 3 H), 5.42 - 5.49 (m, 1 H), 6.79 - 6.86 (m, 2 H), 7.11 - 7.16 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 351 [M+H]+	1
90		(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-フルオロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.21 - 4.32 (m, 4 H), 5.45 - 5.50 (m, 1 H), 6.82 - 6.85 (m, 2 H), 7.30 - 7.33 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 369 [M+H]+	2

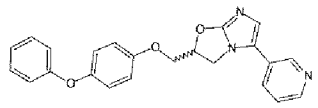
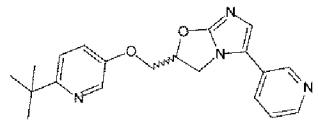
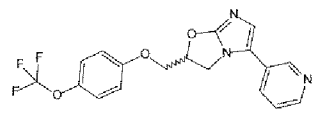
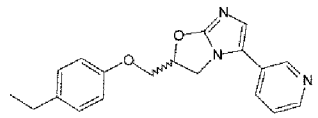
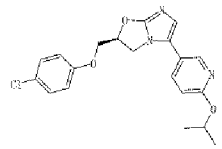
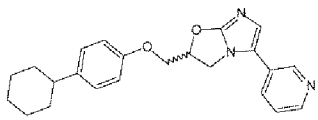
[0205]

[表2-16]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
91		(2S)-2-{[4-(プロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ ppm 1.16 (d, J=7.0 Hz, 6 H), 2.78 - 2.88 (m, 1 H), 4.05 - 4.11 (m, 1 H), 4.24 - 4.40 (m, 3 H), 5.59 - 5.66 (m, 1 H), 6.85 - 6.89 (m, 2 H), 6.95 (br. s., 1 H), 7.05 (br. s., 1 H), 7.13 - 7.18 (m, 2 H), 7.35 (s, 1 H); ESI/APCI MS m/z 302 [M+H]+	16
92		(2S)-6-メチル-5-{6-(プロパン-2-イルオキシ)ピリジン-3-イル}-2-{[4-(プロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.19 - 1.23 (m, 6 H), 1.37 (d, J=6.2 Hz, 6 H), 2.25 (s, 3 H), 2.82 - 2.91 (m, 1 H), 4.11 - 4.17 (m, 1 H), 4.22 - 4.34 (m, 3 H), 5.26 - 5.34 (m, 1 H), 5.48 - 5.55 (m, 1 H), 6.73 (d, J=8.7 Hz, 1 H), 6.81 - 6.86 (m, 2 H), 7.12 - 7.17 (m, 2 H), 7.52 (dd, J=8.7, 2.5 Hz, 1 H), 8.13 (d, J=2.5 Hz, 1 H); ESI MS m/z 408 [M+H]+	4
93		2-[(ビフェニル-4-イルオキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.37 - 4.47 (m, 3 H), 4.54 - 4.58 (m, 1 H), 5.65 - 5.70 (m, 1 H), 6.97 - 7.01 (m, 2 H), 7.02 (s, 1 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H), 7.40 - 7.44 (m, 2 H), 7.52 - 7.56 (m, 4 H), 7.70 - 7.73 (m, 1 H), 8.48 - 8.50 (m, 1 H), 8.70 - 8.72 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 370 [M+H]+	10
94		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-カルボキシミド酸メチル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 2.29 (s, 3 H), 3.91 - 4.07 (m, 7 H), 4.24 - 4.30 (m, 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 2 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H); ESI/APCI MS m/z 344 [M+H]+	16
95		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 2.43 (s, 3 H), 4.23 - 4.30 (m, 2 H), 4.36 - 4.41 (m, 1 H), 4.49 - 4.55 (m, 1 H), 5.43 (br. s., 2 H), 5.52 - 5.58 (m, 1 H), 6.81 - 6.86 (m, 2 H), 7.28 - 7.33 (m, 2 H); ESI MS m/z 330 [M+H]+	16
96		2-[(4-シクロプロピルフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.57 - 0.63 (m, 2 H), 0.86 - 0.94 (m, 2 H), 1.81 - 1.88 (m, 1 H), 4.27 - 4.35 (m, 2 H), 4.37 - 4.43 (m, 1 H), 4.48 - 4.55 (m, 1 H), 5.59 - 5.66 (m, 1 H), 6.78 - 6.84 (m, 2 H), 6.97 - 7.04 (m, 3 H), 7.28 - 7.33 (m, 1 H), 7.67 - 7.72 (m, 1 H), 8.44 - 8.50 (m, 1 H), 8.66 - 8.71 (m, 1 H); ESI/APCI MS m/z 334 [M+H]+	32

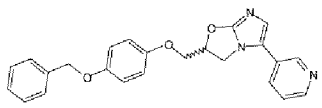
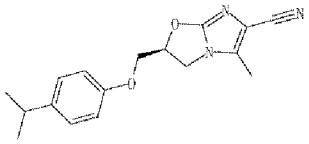
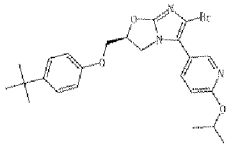
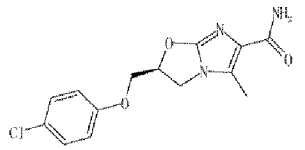
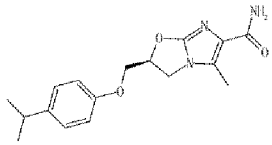
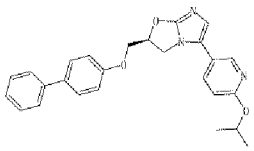
[0206]

[表2-17]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
97		2-[(4-フェノキシフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.33 - 4.36 (m, 2 H), 4.41 - 4.45 (m, 1 H), 4.52 - 4.57 (m, 1 H), 5.62 - 5.67 (m, 1 H), 6.88 - 7.00 (m, 6 H), 7.02 (s, 1 H), 7.04 - 7.08 (m, 1 H), 7.28 - 7.33 (m, 3 H), 7.70 - 7.73 (m, 1 H), 8.48 - 8.50 (m, 1 H), 8.69 - 8.71 (m, 1 H); ESI MS m/z 386 [M+H]+	10
98		2-[[(6-tert-ブチルピリジン-3-イル)オキシ]メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.34 (s, 9 H), 4.37 - 4.44 (m, 3 H), 4.53 - 4.57 (m, 1 H), 5.63 - 5.67 (m, 1 H), 7.01 (s, 1 H), 7.16 - 7.19 (m, 1 H), 7.26 - 7.33 (m, 2 H), 7.69 - 7.72 (m, 1 H), 8.26 - 8.28 (m, 1 H), 8.48 - 8.50 (m, 1 H), 8.69 - 8.71 (m, 1 H); ESI MS m/z 351 [M+H]+	10
99		5-(ピリジン-3-イル)-2-[[4-(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.33 - 4.37 (m, 2 H), 4.39 - 4.43 (m, 1 H), 4.53 - 4.57 (m, 1 H), 5.62 - 5.67 (m, 1 H), 6.90 - 6.94 (m, 2 H), 7.02 (s, 1 H), 7.15 - 7.18 (m, 2 H), 7.30 - 7.33 (m, 1 H), 7.69 - 7.73 (m, 1 H), 8.48 - 8.50 (m, 1 H), 8.69 - 8.71 (m, 1 H); ESI MS m/z 378 [M+H]+	10
100		2-[(4-エチルフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.20 (t, J=7.6 Hz, 3 H), 2.59 (q, J=7.6 Hz, 2 H), 4.28 - 4.37 (m, 2 H), 4.39 - 4.44 (m, 1 H), 4.49 - 4.55 (m, 1 H), 5.59 - 5.66 (m, 1 H), 6.82 - 6.86 (m, 2 H), 7.01 (s, 1 H), 7.10 - 7.15 (m, 2 H), 7.28 - 7.32 (m, 1 H), 7.68 - 7.72 (m, 1 H), 8.46 - 8.50 (m, 1 H), 8.68 - 8.72 (m, 1 H); ESI MS m/z 322 [M+H]+	33
101		(2S)-2-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-5-[6-(プロパン-2-イルオキシ)ピリジン-3-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.36 (dd, J=6.2, 1.7 Hz, 6 H), 4.26 - 4.36 (m, 3 H), 4.42 - 4.49 (m, 1 H), 5.24 - 5.32 (m, 1 H), 5.56 - 5.63 (m, 1 H), 6.71 (d, J=8.7 Hz, 1 H), 6.81 - 6.87 (m, 3 H), 7.23 - 7.28 (m, 2 H), 7.60 (dd, J=8.7, 2.5 Hz, 1 H), 8.19 (d, J=2.5 Hz, 1 H); ESI MS m/z 386 [M+H]+	4
102		2-[(4-シクロヘキシルフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.20 - 1.28 (m, 1 H), 1.34 - 1.42 (m, 4 H), 1.71 - 1.76 (m, 1 H), 1.80 - 1.87 (m, 4 H), 2.42 - 2.48 (m, 1 H), 4.29 - 4.37 (m, 2 H), 4.39 - 4.43 (m, 1 H), 4.49 - 4.54 (m, 1 H), 5.60 - 5.65 (m, 1 H), 6.82 - 6.86 (m, 2 H), 7.01 (s, 1 H), 7.12 - 7.15 (m, 2 H), 7.28 - 7.32 (m, 1 H), 7.68 - 7.72 (m, 1 H), 8.47 - 8.50 (m, 1 H), 8.69 - 8.71 (m, 1 H); ESI MS m/z 376 [M+H]+	10

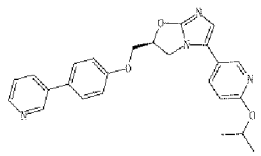
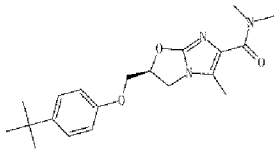
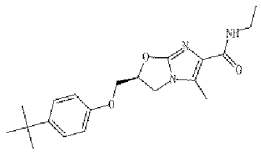
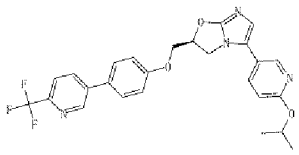
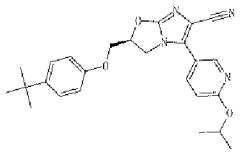
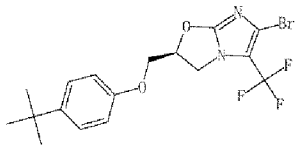
[0207]

[表2-18]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
103		2-{[4-(ベンジルオキシ)フェノキシ]メチル}-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.27 - 4.33 (m, 2 H), 4.39 - 4.44 (m, 1 H), 4.50 - 4.54 (m, 1 H), 5.02 (s, 2 H), 5.59 - 5.64 (m, 1 H), 6.83 - 6.87 (m, 2 H), 6.89 - 6.93 (m, 2 H), 7.01 (s, 1 H), 7.28 - 7.43 (m, 6 H), 7.69 - 7.73 (m, 1 H), 8.47 - 8.50 (m, 1 H), 8.69 - 8.71 (m, 1 H); ESI MS m/z 400 [M+H]+	10
104		(2S)-5-メチル-2-{[4-(プロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.22 (d, J=7.0 Hz, 6 H), 2.31 - 2.36 (m, 3 H), 2.82 - 2.92 (m, 1 H), 4.15 - 4.30 (m, 4 H), 5.54 - 5.60 (m, 1 H), 6.79 - 6.84 (m, 2 H), 7.13 - 7.19 (m, 2 H); ESI MS m/z 298 [M+H]+	5
105		(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-[6-(プロパン-2-イルオキシ)ピリジン-3-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 1.37 (d, J=6.2 Hz, 6 H), 4.22 - 4.37 (m, 4 H), 5.29 - 5.35 (m, 1 H), 5.50 - 5.58 (m, 1 H), 6.72 - 6.76 (m, 1 H), 6.81 - 6.87 (m, 2 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H), 7.76 - 7.80 (m, 1 H), 8.25 - 8.29 (m, 1 H); ESI MS m/z 486 [M+H]+	4
106		(2S)-2-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ ppm 2.39 (s, 3 H), 4.00 - 4.05 (m, 1 H), 4.29 - 4.38 (m, 3 H), 5.61 - 5.66 (m, 1 H), 6.80 (br. s., 1 H), 6.89 (br. s., 1 H), 6.98 - 7.02 (m, 2 H), 7.33 - 7.37 (m, 2 H); ESI MS m/z 308 [M+H]+	16
107		(2S)-5-メチル-2-{[4-(プロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.22 (d, J=7.0 Hz, 6 H), 2.52 (s, 3 H), 2.83 - 2.91 (m, 1 H), 4.10 - 4.17 (m, 1 H), 4.20 - 4.31 (m, 3 H), 5.16 (br. s., 1 H), 5.50 - 5.57 (m, 1 H), 6.72 (br. s., 1 H), 6.81 - 6.86 (m, 2 H), 7.13 - 7.18 (m, 2 H); ESI MS m/z 316 [M+H]+	16
108		(2S)-2-{(ビフェニル-4-イルオキシ)メチル]-5-[6-(プロパン-2-イルオキシ)ピリジン-3-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.36 (dd, J=6.2, 1.7 Hz, 6 H), 4.33 - 4.42 (m, 3 H), 4.45 - 4.51 (m, 1 H), 5.25 - 5.32 (m, 1 H), 5.60 - 5.67 (m, 1 H), 6.70 - 6.74 (m, 1 H), 6.83 (s, 1 H), 6.96 - 7.01 (m, 2 H), 7.29 - 7.34 (m, 1 H), 7.39 - 7.44 (m, 2 H), 7.51 - 7.56 (m, 4 H), 7.62 (dd, J=8.7, 2.5 Hz, 1 H), 8.20 (d, J=2.5 Hz, 1 H); ESI MS m/z 428 [M+H]+	12

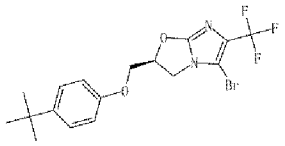
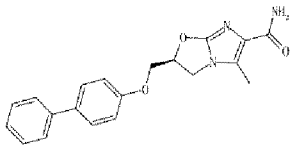
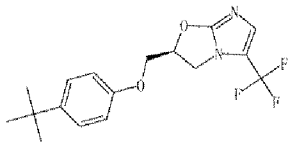
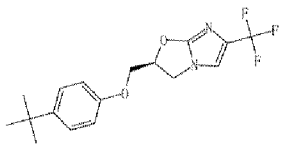
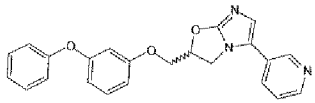
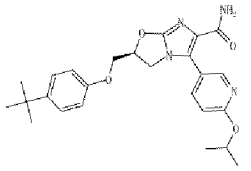
[0208]

[表2-19]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
109		(2S)-5-[6-(プロパン-2-イルオキシ)ピリジン-3-イル]-2-{[4-(ピリジン-3-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.36 (dd, J=6.2, 2.1 Hz, 6 H), 4.34 - 4.43 (m, 3 H), 4.46 - 4.51 (m, 1 H), 5.25 - 5.33 (m, 1 H), 5.61 - 5.68 (m, 1 H), 6.70 - 6.74 (m, 1 H), 6.84 (s, 1 H), 6.99 - 7.05 (m, 2 H), 7.32 - 7.37 (m, 1 H), 7.50 - 7.56 (m, 2 H), 7.60 - 7.64 (m, 1 H), 7.81 - 7.85 (m, 1 H), 8.18 - 8.22 (m, 1 H), 8.54 - 8.58 (m, 1 H), 8.78 - 8.83 (m, 1 H); ESI MS m/z 429	12
110		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-N,N,5-トリメチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.28 - 1.31 (m, 9 H), 2.40 - 2.43 (m, 3 H), 3.02 (br. s, 3 H), 3.33 (br. s, 3 H), 4.10 - 4.14 (m, 1 H), 4.20 - 4.30 (m, 3 H), 5.48 - 5.55 (m, 1 H), 6.82 - 6.85 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H); ESI MS m/z 358 [M+H]+	19
111		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-N-エチル-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.17 - 1.23 (m, 3 H), 1.30 (s, 9 H), 2.52 (s, 3 H), 3.35 - 3.42 (m, 2 H), 4.10 - 4.15 (m, 1 H), 4.20 - 4.30 (m, 3 H), 5.50 - 5.55 (m, 1 H), 6.80 - 6.88 (m, 3 H), 7.30 - 7.33 (m, 2 H); ESI MS m/z 358 [M+H]+	19
112		(2S)-5-[6-(プロパン-2-イルオキシ)ピリジン-3-イル]-2-({4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.36 (dd, J=6.2, 2.1 Hz, 6 H), 4.33 - 4.44 (m, 3 H), 4.47 - 4.52 (m, 1 H), 5.24 - 5.33 (m, 1 H), 5.61 - 5.68 (m, 1 H), 6.70 - 6.75 (m, 1 H), 6.84 (s, 1 H), 7.03 - 7.09 (m, 2 H), 7.54 - 7.58 (m, 2 H), 7.60 - 7.65 (m, 1 H), 7.70 - 7.76 (m, 1 H), 7.96 - 8.01 (m, 1 H), 8.17 - 8.22 (m, 1 H), 8.88 - 8.92 (m, 1 H); ESI MS m/z 497 [M+H]+	12
113		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-[6-(プロパン-2-イルオキシ)ピリジン-3-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 1.37 (dd, J=6.2, 1.2 Hz, 6 H), 4.28 - 4.49 (m, 4 H), 5.30 - 5.38 (m, 1 H), 5.60 - 5.67 (m, 1 H), 6.78 - 6.85 (m, 3 H), 7.29 - 7.35 (m, 2 H), 7.90 (dd, J=8.7, 2.5 Hz, 1 H), 8.34 (d, J=2.5 Hz, 1 H); ESI MS m/z 433 [M+H]+	5
114		(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.25 - 4.41 (m, 4 H), 5.55 - 5.61 (m, 1 H), 6.80 - 6.85 (m, 2 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H); ESI MS m/z 419 [M+H]+	1

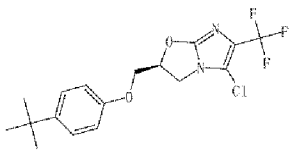
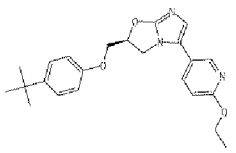
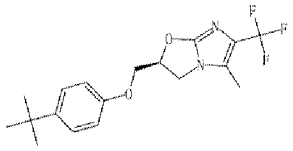
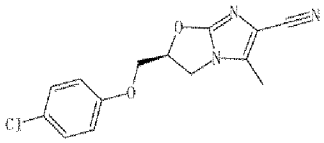
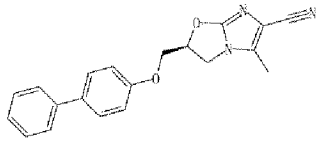
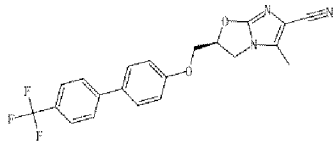
[0209]

[表2-20]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
115		(2S)-5-ブロモ-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.21 - 4.34 (m, 4 H), 5.56 - 5.63 (m, 1 H), 6.81 - 6.86 (m, 2 H), 7.30 - 7.35 (m, 2 H); ESI MS m/z 419 [M+H]+	1
116		(2S)-2-[(ビフェニル-4-イルオキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.53 (s, 3 H), 4.15 - 4.19 (m, 1 H), 4.24 - 4.28 (m, 1 H), 4.33 - 4.36 (m, 2 H), 5.18 (br. s., 1 H), 5.55 - 5.60 (m, 1 H), 6.73 (br. s., 1 H), 6.96 - 6.99 (m, 2 H), 7.30 - 7.34 (m, 1 H), 7.40 - 7.44 (m, 2 H), 7.52 - 7.56 (m, 4 H); ESI MS m/z 350 [M+H]+	20
117		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.24 - 4.40 (m, 4 H), 5.57 - 5.66 (m, 1 H), 6.78 - 6.88 (m, 2 H), 7.06 (d, J=2.1 Hz, 1 H), 7.29 - 7.35 (m, 2 H); ESI MS m/z 341 [M+H]+	6
118		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-6-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 - 1.31 (m, 9 H), 4.23 - 4.36 (m, 4 H), 5.53 - 5.60 (m, 1 H), 6.80 - 6.87 (m, 2 H), 6.98 (d, J=1.2 Hz, 1 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H); ESI MS m/z 341 [M+H]+	6
119		2-[(3-フェノキシフェノキシ)メチル]-5-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.29 - 4.33 (m, 2 H), 4.37 - 4.42 (m, 1 H), 4.50 - 4.54 (m, 1 H), 5.59 - 5.65 (m, 1 H), 6.55 - 6.58 (m, 1 H), 6.63 - 6.67 (m, 2 H), 6.99 - 7.04 (m, 3 H), 7.10 - 7.15 (m, 1 H), 7.22 - 7.25 (m, 1 H), 7.28 - 7.37 (m, 3 H), 7.68 - 7.72 (m, 1 H), 8.47 - 8.50 (m, 1 H), 8.69 (br. s, 1 H); ESI MS m/z 386 [M+H]+	10
120		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-[6-(プロパン-2-イルオキシ)ピリジン-3-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 1.36 (d, J=6.2 Hz, 6 H), 4.24 - 4.37 (m, 4 H), 5.24 - 5.35 (m, 2 H), 5.55 - 5.62 (m, 1 H), 6.74 (dd, J=8.7, 0.8 Hz, 1 H), 6.80 - 6.85 (m, 2 H), 6.90 (br. s., 1 H), 7.28 - 7.35 (m, 2 H), 8.02 (dd, J=8.7, 2.5 Hz, 1 H), 8.27 (d, J=2.5 Hz, 1 H); ESI MS m/z 461 [M+H]+	16

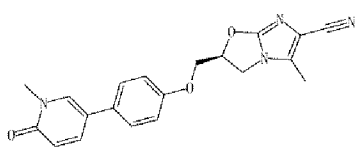
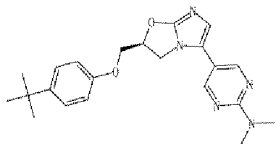
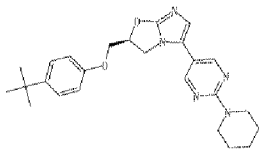
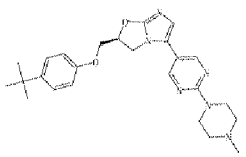
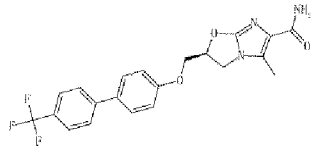
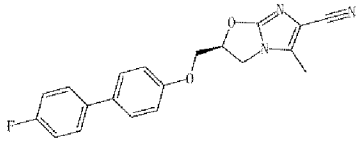
[0210]

[表2-21]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
121		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-クロロ-6-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 4.23 - 4.34 (m, 4 H), 5.56 - 5.62 (m, 1 H), 6.82 - 6.86 (m, 2 H), 7.30 - 7.35 (m, 2 H); ESI MS m/z 375 [M+H]+	2
122		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-(6-エトキシピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 1.40 (t, J=7.0 Hz, 3 H), 4.25 - 4.47 (m, 6 H), 5.56 - 5.62 (m, 1 H), 6.73 - 6.78 (m, 1 H), 6.81 - 6.87 (m, 3 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H), 7.59 - 7.64 (m, 1 H), 8.17 - 8.21 (m, 1 H); ESI MS m/z 394 [M+H]+	4
123		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-6-(トリフルオロメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 2.28 (q, J=1.9 Hz, 3 H), 4.11 - 4.16 (m, 1 H), 4.19 - 4.35 (m, 3 H), 5.51 - 5.57 (m, 1 H), 6.82 - 6.86 (m, 2 H), 7.30 - 7.34 (m, 2 H); ESI MS m/z 355 [M+H]+	4
124		(2S)-2-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 4.16 - 4.20 (m, 1 H), 4.24 - 4.32 (m, 3 H), 5.55 - 5.61 (m, 1 H), 6.80 - 6.85 (m, 2 H), 7.23 - 7.28 (m, 2 H); ESI MS m/z 290 [M+H]+	11
125		(2S)-2-[(ビフェニル-4-イルオキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 4.19 - 4.24 (m, 1 H), 4.26 - 4.30 (m, 1 H), 4.32 - 4.38 (m, 2 H), 5.58 - 5.64 (m, 1 H), 6.94 - 6.98 (m, 2 H), 7.30 - 7.34 (m, 1 H), 7.39 - 7.45 (m, 2 H), 7.51 - 7.56 (m, 4 H); ESI MS m/z 332 [M+H]+	13
126		(2S)-5-メチル-2-({[4'-(トリフルオロメチル)ビフェニル-4-イル]オキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 4.20 - 4.32 (m, 2 H), 4.33 - 4.40 (m, 2 H), 5.60 - 5.64 (m, 1 H), 6.98 - 7.00 (m, 2 H), 7.54 - 7.57 (m, 2 H), 7.62 - 7.69 (m, 4 H); ESI MS m/z 400 [M+H]+	13

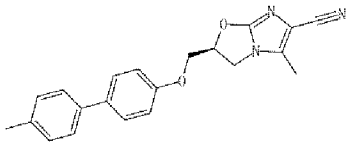
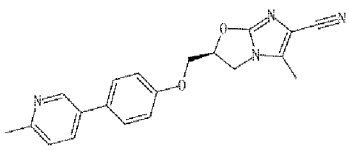
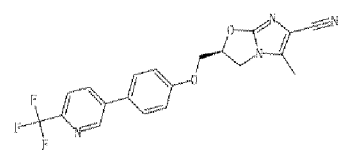
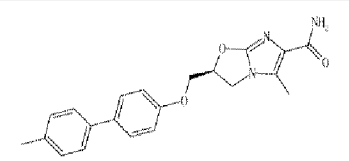
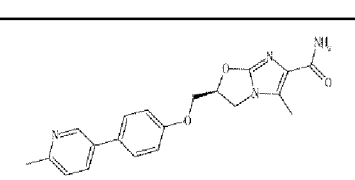
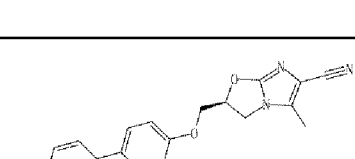
[0211]

[表2-22]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
127		(2S)-5-メチル-2-{[4-(1-メチル-6-オキソ-1,6-ジヒドロピリジン-3-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 3.62 (s, 3 H), 4.19 - 4.38 (m, 4 H), 5.58 - 5.63 (m, 1 H), 6.64 - 6.67 (m, 1 H), 6.92 - 6.95 (m, 2 H), 7.32 - 7.35 (m, 2 H), 7.42 - 7.44 (m, 1 H), 7.55 - 7.58 (m, 1 H); ESI MS m/z 363 [M+H]+	13
128		5-{(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-イル}-N,N-ジメチルピリミジン-2-アミン	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 3.21 (s, 6 H), 4.23 - 4.40 (m, 4 H), 5.55 - 5.61 (m, 1 H), 6.76 (s, 1 H), 6.82 - 6.86 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H), 8.38 (s, 2 H); ESI MS m/z 394 [M+H]+	4
129		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-[2-(ピペリジン-1-イル)ピリミジン-5-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 1.55 - 1.65 (m, 4 H), 1.66 - 1.73 (m, 2 H), 3.78 - 3.83 (m, 4 H), 4.21 - 4.40 (m, 4 H), 5.55 - 5.61 (m, 1 H), 6.75 (s, 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H), 8.35 (s, 2 H); ESI MS m/z 434 [M+H]+	4
130		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-[2-(4-メチルピペラジン-1-イル)ピリミジン-5-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (s, 9 H), 2.36 (s, 3 H), 2.45 - 2.56 (m, 2 H), 3.81 - 3.92 (m, 2 H), 4.24 - 4.40 (m, 4 H), 5.56 - 5.61 (m, 1 H), 6.77 (s, 1 H), 6.82 - 6.86 (m, 2 H), 7.29 - 7.33 (m, 2 H), 8.37 (s, 2 H); ESI MS m/z 449 [M+H]+	4
131		(2S)-5-メチル-2-({[4'-(トリフルオロメチル)ビフェニル-4-イル]オキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.54 (s, 3 H), 4.16 - 4.20 (m, 1 H), 4.24 - 4.30 (m, 1 H), 4.33 - 4.38 (m, 2 H), 5.14 (br. s., 1 H), 5.56 - 5.61 (m, 1 H), 6.71 (br. s., 1 H), 6.99 - 7.02 (m, 2 H), 7.54 - 7.57 (m, 2 H), 7.62 - 7.69 (m, 4 H); ESI MS m/z 418 [M+H]+	15
132		(2S)-2-{[(4'-フルオロビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 4.20 - 4.38 (m, 4 H), 5.59 - 5.64 (m, 1 H), 6.94 - 6.97 (m, 2 H), 7.09 - 7.13 (m, 2 H), 7.46 - 7.50 (m, 4 H); ESI MS m/z 350 [M+H]+	13

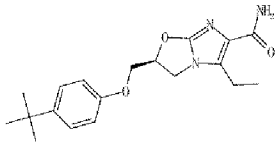
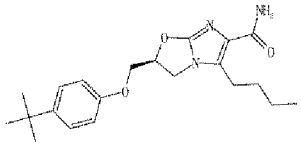
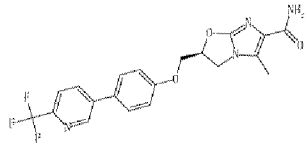
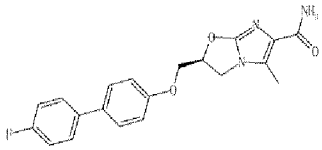
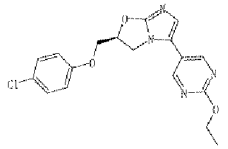
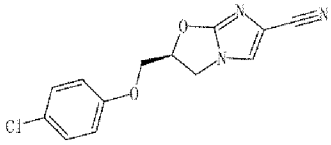
[0212]

[表2-23]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
133		(2S)-5-メチル-2-{[(4'-メチルビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 2.39 (s, 3 H), 4.19 - 4.30 (m, 2 H), 4.33 - 4.35 (m, 2 H), 5.58 - 5.63 (m, 1 H), 6.93 - 6.96 (m, 2 H), 7.22 - 7.25 (m, 2 H), 7.42 - 7.45 (m, 2 H), 7.50 - 7.53 (m, 2 H); ESI MS m/z 346 [M+H]+	13
134		(2S)-5-メチル-2-{[4-(6-メチルピリジン-3-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 2.59 (s, 3 H), 4.20 - 4.31 (m, 2 H), 4.32 - 4.39 (m, 2 H), 5.59 - 5.64 (m, 1 H), 6.96 - 7.01 (m, 2 H), 7.19 - 7.22 (m, 1 H), 7.49 - 7.53 (m, 2 H), 7.70 - 7.74 (m, 1 H), 8.66 - 8.69 (m, 1 H); ESI MS m/z 347 [M+H]+	13
135		(2S)-5-メチル-2-({4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 4.19 - 4.44 (m, 4 H), 5.59 - 5.66 (m, 1 H), 7.01 - 7.06 (m, 2 H), 7.53 - 7.60 (m, 2 H), 7.71 - 7.76 (m, 1 H), 7.96 - 8.01 (m, 1 H), 8.87 - 8.93 (m, 1 H); ESI MS m/z 401 [M+H]+	13
136		(2S)-5-メチル-2-{[(4'-メチルビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.38 (s, 3 H), 2.53 (s, 3 H), 4.15 - 4.20 (m, 1 H), 4.24 - 4.28 (m, 1 H), 4.32 - 4.35 (m, 2 H), 5.13 (br. s., 1 H), 5.54 - 5.60 (m, 1 H), 6.72 (br. s., 1 H), 6.94 - 6.97 (m, 2 H), 7.22 - 7.25 (m, 2 H), 7.42 - 7.46 (m, 2 H), 7.49 - 7.53 (m, 2 H); ESI MS m/z 364 [M+H]+	15
137		(2S)-5-メチル-2-{[4-(6-メチルピリジン-3-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.54 (s, 3 H), 2.59 (s, 3 H), 4.15 - 4.20 (m, 1 H), 4.25 - 4.29 (m, 1 H), 4.32 - 4.38 (m, 2 H), 5.13 (br. s, 1 H), 5.55 - 5.61 (m, 1 H), 6.72 (br. s, 1 H), 6.97 - 7.02 (m, 2 H), 7.18 - 7.22 (m, 1 H), 7.49 - 7.53 (m, 2 H), 7.70 - 7.74 (m, 1 H), 8.67 - 8.70 (m, 1 H); ESI MS m/z 365 [M+H]+	15
138		(2S)-2-{[(4'-メトキシビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 3.85 (s, 3 H), 4.19 - 4.37 (m, 4 H), 5.57 - 5.63 (m, 1 H), 6.92 - 6.98 (m, 4 H), 7.44 - 7.51 (m, 4 H); ESI MS m/z 362 [M+H]+	13

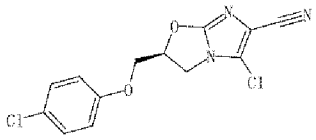
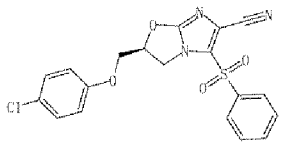
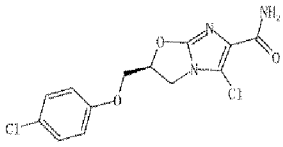
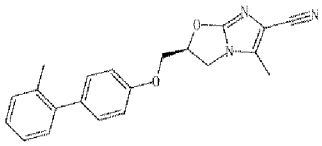
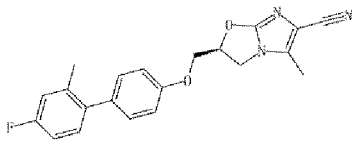
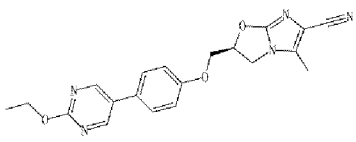
[0213]

[表2-24]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
139		(2S)-2-[(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.20 - 1.24 (m, 3 H), 1.30 (s, 9 H), 2.99 - 3.05 (m, 2 H), 4.14 - 4.19 (m, 1 H), 4.24 - 4.29 (m, 3 H), 5.23 (br. s, 1 H), 5.50 - 5.56 (m, 1 H), 6.76 (br. s, 1 H), 6.81 - 6.85 (m, 2 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H); ESI MS m/z 344 [M+H]+	17
140		(2S)-5-ブチル-2-{(4-tert-ブチルフェノキシ)メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.91 - 0.96 (m, 3 H), 1.30 (s, 9 H), 1.35 - 1.43 (m, 2 H), 1.55 - 1.63 (m, 2 H), 2.93 - 3.04 (m, 2 H), 4.13 - 4.17 (m, 1 H), 4.22 - 4.30 (m, 3 H), 5.17 (br. s, 1 H), 5.49 - 5.56 (m, 1 H), 6.75 (br. s, 1 H), 6.80 - 6.85 (m, 2 H), 7.29 - 7.34 (m, 2 H); ESI MS m/z 372 [M+H]+	18
141		(2S)-5-メチル-2-({4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.54 (s, 3 H), 4.15 - 4.22 (m, 1 H), 4.26 - 4.43 (m, 3 H), 5.16 (br. s., 1 H), 5.56 - 5.63 (m, 1 H), 6.72 (br. s., 1 H), 7.02 - 7.08 (m, 2 H), 7.52 - 7.60 (m, 2 H), 7.71 - 7.76 (m, 1 H), 7.97 - 8.01 (m, 1 H), 8.88 - 8.92 (m, 1 H); ESI MS m/z 419 [M+H]+	15
142		(2S)-2-{[(4'-フルオロビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.54 (s, 3 H), 4.15 - 4.20 (m, 1 H), 4.24 - 4.38 (m, 3 H), 5.16 (br. s., 1 H), 5.54 - 5.61 (m, 1 H), 6.73 (br. s., 1 H), 6.94 - 6.99 (m, 2 H), 7.07 - 7.14 (m, 2 H), 7.45 - 7.53 (m, 4 H); ESI MS m/z 368 [M+H]+	15
143		(2S)-2-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-5-(2-エトキシピリミジン-5-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.45 (t, J=7.0 Hz, 3 H), 4.29 - 4.37 (m, 3 H), 4.41 - 4.49 (m, 3 H), 5.60 - 5.67 (m, 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 2 H), 6.91 (s, 1 H), 7.22 - 7.31 (m, 2 H), 8.54 - 8.59 (m, 2 H); ESI MS m/z 373 [M+H]+	4
144		(2S)-2-[(4-クロロフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.24 - 4.41 (m, 4 H), 5.56 - 5.63 (m, 1 H), 6.79 - 6.84 (m, 2 H), 7.23 (s, 1 H), 7.24 - 7.28 (m, 2 H); ESI MS m/z 276 [M+H]+	5

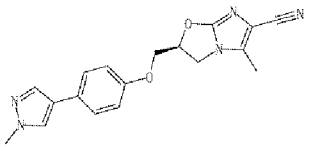
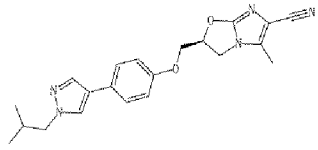
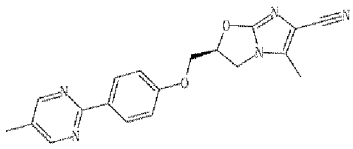
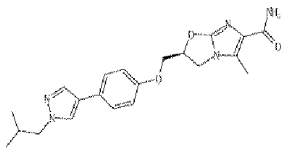
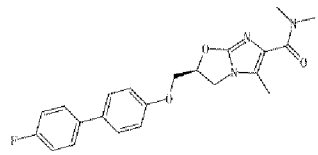
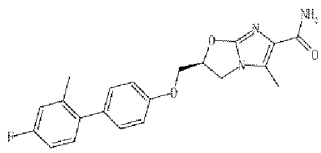
[0214]

[表2-25]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
145		(2S)-5-クロロ-2-{(4-クロロフェノキシ)メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.24 - 4.38 (m, 4 H), 5.60 - 5.65 (m, 1 H), 6.81 - 6.84 (m, 2 H), 7.26 - 7.29 (m, 2 H); ESI MS m/z 310 [M+H]+	11
146		(2S)-2-{(4-クロロフェノキシ)メチル}-5-(フェニルスルホニル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.21 - 4.25 (m, 1 H), 4.35 - 4.39 (m, 1 H), 4.47 - 4.58 (m, 2 H), 5.65 - 5.69 (m, 1 H), 6.68 - 6.72 (m, 2 H), 7.22 - 7.27 (m, 2 H), 7.60 - 7.65 (m, 2 H), 7.71 - 7.74 (m, 1 H), 8.04 - 8.08 (m, 2 H); ESI MS m/z 416 [M+H]+	11
147		(2S)-5-クロロ-2-{(4-クロロフェノキシ)メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 4.23 - 4.28 (m, 2 H), 4.31 - 4.37 (m, 2 H), 5.24 (br. s., 1 H), 5.57 - 5.61 (m, 1 H), 6.68 (br. s., 1 H), 6.82 - 6.86 (m, 2 H), 7.26 - 7.28 (m, 2 H); ESI MS m/z 328 [M+H]+	16
148		(2S)-5-メチル-2-{[(2'-メチルビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.25 (s, 3 H), 2.36 (s, 3 H), 4.20 - 4.40 (m, 4 H), 5.58 - 5.65 (m, 1 H), 6.90 - 6.96 (m, 2 H), 7.16 - 7.29 (m, 6 H); ESI MS m/z 346 [M+H]+	13
149		(2S)-2-{[(4'-フルオロ-2'-メチルビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.23 (s, 3 H), 2.36 (s, 3 H), 4.20 - 4.40 (m, 4 H), 5.59 - 5.66 (m, 1 H), 6.88 - 6.99 (m, 4 H), 7.11 - 7.16 (m, 1 H), 7.19 - 7.24 (m, 2 H); ESI MS m/z 364 [M+H]+	13
150		(2S)-2-{[4-(2-エトキシピリミジン-5-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.47 (t, J=7.0 Hz, 3 H), 2.36 (s, 3 H), 4.20 - 4.40 (m, 4 H), 4.44 - 4.51 (m, 2 H), 5.59 - 5.65 (m, 1 H), 6.98 - 7.02 (m, 2 H), 7.43 - 7.48 (m, 2 H), 8.66 (s, 2 H); ESI MS m/z 378 [M+H]+	13

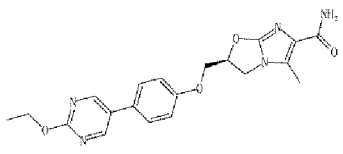
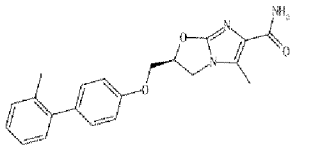
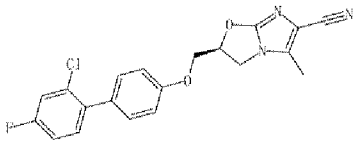
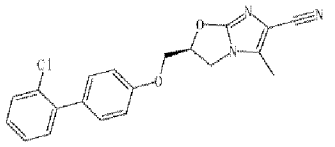
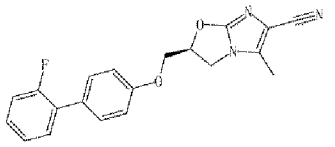
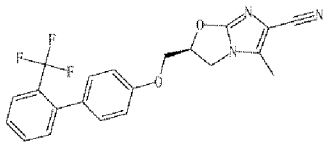
[0215]

[表2-26]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
151		(2S)-5-メチル-2-{[4-(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 3.94 (s, 3 H), 4.18 - 4.34 (m, 4 H), 5.57 - 5.61 (m, 1 H), 6.87 - 6.90 (m, 2 H), 7.38 - 7.41 (m, 2 H), 7.54 (s, 1 H), 7.69 (s, 1 H); ESI MS m/z 336 [M+H]+	13
152		(2S)-5-メチル-2-({4-[1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.94 (d, J=6.6 Hz, 6 H), 2.20 - 2.27 (m, 1 H), 2.35 (s, 3 H), 3.93 (d, J=7.4 Hz, 2 H), 4.19 - 4.35 (m, 4 H), 5.57 - 5.62 (m, 1 H), 6.87 - 6.91 (m, 2 H), 7.39 - 7.43 (m, 2 H), 7.54 (s, 1 H), 7.71 (s, 1 H); ESI MS m/z 378 [M+H]+	13
153		(2S)-5-メチル-2-{[4-(5-メチルピリミジン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.33 (s, 3 H), 2.36 (s, 3 H), 4.20 - 4.31 (m, 2 H), 4.35 - 4.41 (m, 2 H), 5.59 - 5.65 (m, 1 H), 6.96 - 7.00 (m, 2 H), 8.35 - 8.39 (m, 2 H), 8.60 (s, 2 H); ESI MS m/z 348 [M+H]+	14
154		(2S)-5-メチル-2-({4-[1-(2-メチルプロピル)-1H-ピラゾール-4-イル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.93 - 0.95 (m, 6 H), 2.20 - 2.26 (m, 1 H), 2.53 (s, 3 H), 3.93 (d, J=6.6 Hz, 2 H), 4.15 - 4.19 (m, 1 H), 4.23 - 4.28 (m, 1 H), 4.30 - 4.32 (m, 2 H), 5.14 (br. s., 1 H), 5.54 - 5.59 (m, 1 H), 6.75 (br. s., 1 H), 6.88 - 6.92 (m, 2 H), 7.39 - 7.42 (m, 2 H), 7.54 (s, 1 H), 7.71 (s, 1 H); ESI MS m/z 396 [M+H]+	15
155		(2S)-2-({[4'-フルオロビフェニル-4-イル]オキシ}メチル)-N,N,5-トリメチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.43 (s, 3 H), 3.03 (br. s., 3 H), 3.33 (br. s., 3 H), 4.13 - 4.18 (m, 1 H), 4.23 - 4.37 (m, 3 H), 5.51 - 5.60 (m, 1 H), 6.94 - 6.99 (m, 2 H), 7.07 - 7.14 (m, 2 H), 7.44 - 7.51 (m, 4 H); ESI MS m/z 396 [M+H]+	19
156		(2S)-2-{[(4'-フルオロ-2'-メチルビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.23 (s, 3 H), 2.54 (s, 3 H), 4.15 - 4.38 (m, 4 H), 5.16 (br. s., 1 H), 5.55 - 5.62 (m, 1 H), 6.73 (br. s., 1 H), 6.88 - 6.99 (m, 4 H), 7.11 - 7.16 (m, 1 H), 7.19 - 7.24 (m, 2 H); ESI MS m/z 382 [M+H]+	15

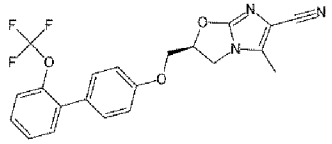
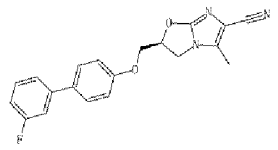
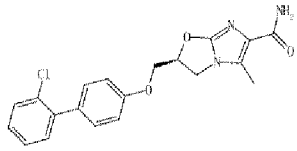
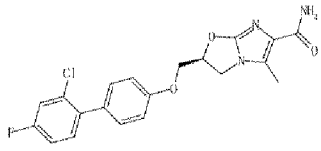
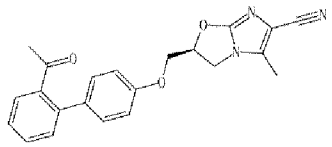
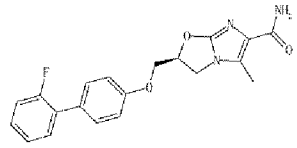
[0216]

[表2-27]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
157		(2S)-2-{[4-(2-エトキシピリミジン-5-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.46 (t, J=7.0 Hz, 3 H), 2.54 (s, 3 H), 4.15 - 4.20 (m, 1 H), 4.25 - 4.39 (m, 3 H), 4.47 (q, J=7.0 Hz, 2 H), 5.14 (br. s., 1 H), 5.54 - 5.62 (m, 1 H), 6.72 (br. s., 1 H), 7.01 (d, J=8.7 Hz, 2 H), 7.42 - 7.48 (m, 2 H), 8.66 (s, 2 H); ESI MS m/z 396 [M+H]+	15
158		(2S)-5-メチル-2-{[(2'-メチルビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.26 (s, 3 H), 2.54 (s, 3 H), 4.15 - 4.37 (m, 4 H), 5.17 (br. s., 1 H), 5.54 - 5.62 (m, 1 H), 6.73 (br. s., 1 H), 6.90 - 6.98 (m, 2 H), 7.17 - 7.33 (m, 6 H); ESI MS m/z 364 [M+H]+	15
159		(2S)-2-{[(2'-クロロ-4'-フルオロビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 4.20 - 4.39 (m, 4 H), 5.59 - 5.64 (m, 1 H), 6.93 - 6.97 (m, 2 H), 7.01 - 7.05 (m, 1 H), 7.20 - 7.29 (m, 2 H), 7.33 - 7.37 (m, 2 H); ESI MS m/z 384 [M+H]+	14
160		(2S)-2-{[(2'-クロロビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 4.20 - 4.30 (m, 2 H), 4.33 - 4.39 (m, 2 H), 5.59 - 5.64 (m, 1 H), 6.94 - 6.97 (m, 2 H), 7.25 - 7.32 (m, 3 H), 7.38 - 7.41 (m, 2 H), 7.45 - 7.47 (m, 1 H); ESI MS m/z 366 [M+H]+	14
161		(2S)-2-{[(2'-フルオロビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 4.18 - 4.39 (m, 4 H), 5.58 - 5.65 (m, 1 H), 6.93 - 6.99 (m, 2 H), 7.11 - 7.22 (m, 2 H), 7.27 - 7.32 (m, 1 H), 7.37 - 7.42 (m, 1 H), 7.48 - 7.53 (m, 2 H); ESI MS m/z 350 [M+H]+	13
162		(2S)-5-メチル-2-({[2'-(トリフルオロメチル)ビフェニル-4-イル]オキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 4.19 - 4.40 (m, 4 H), 5.55 - 5.67 (m, 1 H), 6.89 - 6.95 (m, 2 H), 7.23 - 7.34 (m, 3 H), 7.42 - 7.49 (m, 1 H), 7.52 - 7.57 (m, 1 H), 7.70 - 7.77 (m, 1 H); ESI MS m/z 400 [M+H]+	13

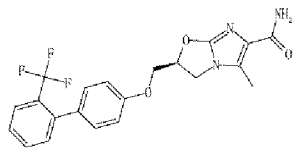
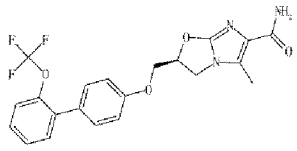
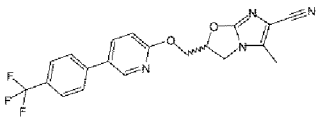
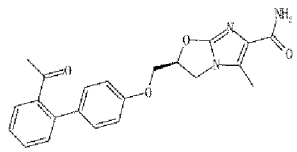
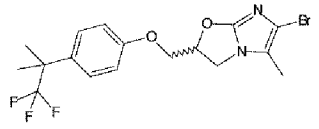
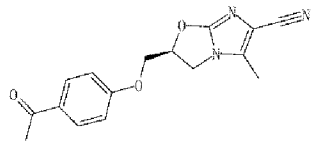
[0217]

[表2-28]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
163		(2S)-5-メチル-2-({[2'-(トリフルオロメトキシ)ビフェニル-4-イル]オキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 4.19 - 4.41 (m, 4 H), 5.55 - 5.66 (m, 1 H), 6.85 - 7.00 (m, 2 H), 7.30 - 7.46 (m, 6 H); ESI MS m/z 416 [M+H]+	13
164		(2S)-2-{[(3'-フルオロビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 4.18 - 4.24 (m, 1 H), 4.26 - 4.40 (m, 3 H), 5.56 - 5.65 (m, 1 H), 6.91 - 7.04 (m, 3 H), 7.20 - 7.26 (m, 1 H), 7.29 - 7.41 (m, 2 H), 7.48 - 7.54 (m, 2 H); ESI MS m/z 350 [M+H]+	13
165		(2S)-2-{[(2'-クロロビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.54 (s, 3 H), 4.16 - 4.20 (m, 1 H), 4.25 - 4.29 (m, 1 H), 4.34 - 4.36 (m, 2 H), 5.13 (br. s., 1 H), 5.56 - 5.61 (m, 1 H), 6.73 (br. s., 1 H), 6.95 - 6.98 (m, 2 H), 7.25 - 7.33 (m, 3 H), 7.38 - 7.41 (m, 2 H), 7.45 - 7.47 (m, 1 H); ESI MS m/z 384 [M+H]+	15
166		(2S)-2-{[(2'-クロロ-4'-フルオロビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.54 (s, 3 H), 4.17 - 4.21 (m, 1 H), 4.26 - 4.30 (m, 1 H), 4.33 - 4.38 (m, 2 H), 5.18 (br. s., 1 H), 5.58 - 5.63 (m, 1 H), 6.81 (br. s., 1 H), 6.94 - 6.98 (m, 2 H), 7.01 - 7.05 (m, 1 H), 7.20 - 7.30 (m, 2 H), 7.33 - 7.36 (m, 2 H); ESI MS m/z 402 [M+H]+	15
167		(2S)-2-{[(2'-アセチルビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.06 (s, 3 H), 2.36 (s, 3 H), 4.21 - 4.39 (m, 4 H), 5.60 - 5.64 (m, 1 H), 6.93 - 6.96 (m, 2 H), 7.27 - 7.29 (m, 2 H), 7.34 - 7.42 (m, 2 H), 7.48 - 7.55 (m, 2 H); ESI MS m/z 374 [M+H]+	14
168		(2S)-2-{[(2'-フルオロビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.54 (s, 3 H), 4.15 - 4.38 (m, 4 H), 5.15 (br. s., 1 H), 5.55 - 5.63 (m, 1 H), 6.74 (br. s., 1 H), 6.95 - 7.02 (m, 2 H), 7.11 - 7.22 (m, 2 H), 7.27 - 7.33 (m, 1 H), 7.37 - 7.43 (m, 1 H), 7.47 - 7.54 (m, 2 H); ESI MS m/z 368 [M+H]+	15

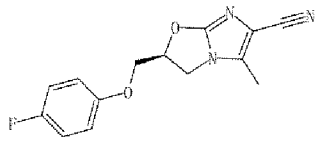
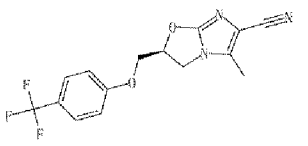
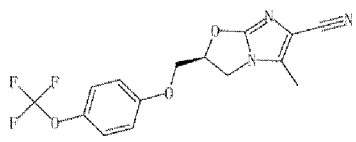
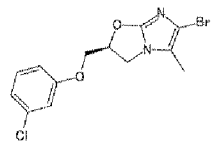
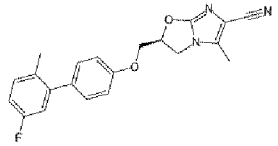
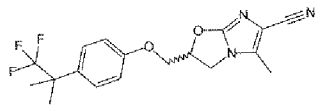
[0218]

[表2-29]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
169		(2S)-5-メチル-2-({[2'-(トリフルオロメチル)ビフェニル-4-イル]オキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.54 (s, 3 H), 4.17 - 4.38 (m, 4 H), 5.15 (br. s., 1 H), 5.59 (br. s., 1 H), 6.75 (br. s., 1 H), 6.90 - 6.95 (m, 2 H), 7.24 - 7.33 (m, 3 H), 7.43 - 7.48 (m, 1 H), 7.52 - 7.58 (m, 1 H), 7.71 - 7.76 (m, 1 H); ESI MS m/z 418 [M+H]+	15
170		(2S)-5-メチル-2-({[2'-(トリフルオロメトキシ)ビフェニル-4-イル]オキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.54 (s, 3 H), 4.17 - 4.38 (m, 4 H), 5.15 (br. s., 1 H), 5.56 - 5.63 (m, 1 H), 6.76 (br. s., 1 H), 6.95 - 6.99 (m, 2 H), 7.32 - 7.43 (m, 6 H); ESI MS m/z 434 [M+H]+	15
171		5-メチル-2-[({5-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]ピリジン-2-イル}オキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.34 (s, 3 H), 4.11 - 4.16 (m, 1 H), 4.24 - 4.29 (m, 1 H), 4.71 - 4.78 (m, 2 H), 5.64 - 5.69 (m, 1 H), 6.86 - 6.89 (m, 1 H), 7.62 - 7.65 (m, 2 H), 7.70 - 7.74 (m, 2 H), 7.83 - 7.86 (m, 1 H), 8.36 - 8.38 (m, 1 H); ESI MS m/z 401 [M+H]+	30
172		(2S)-2-{[(2'-アセチルビフェニル-4-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.05 (s, 3 H), 2.54 (s, 3 H), 4.17 - 4.21 (m, 1 H), 4.26 - 4.30 (m, 1 H), 4.32 - 4.38 (m, 2 H), 5.15 (br. s., 1 H), 5.57 - 5.62 (m, 1 H), 6.74 (br. s., 1 H), 6.94 - 6.98 (m, 2 H), 7.27 - 7.29 (m, 2 H), 7.34 - 7.42 (m, 2 H), 7.48 - 7.55 (m, 2 H); ESI MS m/z 392 [M+H]+	15
173		6-ブロモ-5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 2.12 (s, 3 H), 4.05 - 4.11 (m, 1 H), 4.16 - 4.31 (m, 3 H), 5.44 - 5.52 (m, 1 H), 6.84 - 6.92 (m, 2 H), 7.38 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 419 [M+H]+	35
174		(2S)-2-[(4-アセチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 2.57 (s, 3 H), 4.18 - 4.22 (m, 1 H), 4.27 - 4.32 (m, 1 H), 4.34 - 4.42 (m, 2 H), 5.59 - 5.65 (m, 1 H), 6.92 - 6.96 (m, 2 H), 7.93 - 7.97 (m, 2 H); ESI MS m/z 298 [M+H]+	5

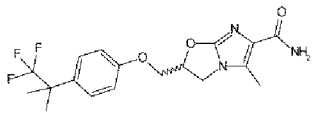
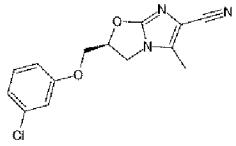
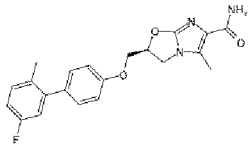
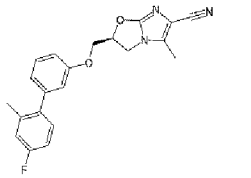
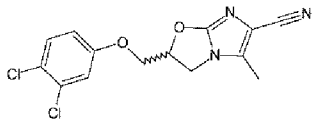
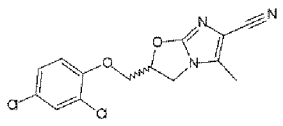
[0219]

[表2-30]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
175		(2S)-2-[(4-フルオロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.34 (s, 3 H), 4.15 - 4.31 (m, 4 H), 5.54 - 5.61 (m, 1 H), 6.81 - 6.86 (m, 2 H), 6.95 - 7.02 (m, 2 H); ESI MS m/z 274 [M+H]+	5
176		(2S)-5-メチル-2-{[4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.34 (s, 3 H), 4.19 (dd, J=9.9, 6.6 Hz, 1 H), 4.27 - 4.41 (m, 3 H), 5.59 - 5.65 (m, 1 H), 6.97 (d, J=8.7 Hz, 2 H), 7.57 (d, J=8.7 Hz, 2 H); ESI MS m/z 324 [M+H]+	5
177		(2S)-5-メチル-2-{[4-(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.34 (s, 3 H), 4.18 (dd, J=9.7, 6.4 Hz, 1 H), 4.26 - 4.35 (m, 3 H), 5.57 - 5.62 (m, 1 H), 6.87 - 6.91 (m, 2 H), 7.16 (d, J=8.7 Hz, 2 H); ESI MS m/z 340 [M+H]+	5
178		(2S)-6-ブロモ-2-[(3-クロロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.13 (s, 3 H), 4.07 - 4.29 (m, 4 H), 5.46 - 5.51 (m, 1 H), 6.78 - 6.81 (m, 1 H), 6.89 - 6.92 (m, 1 H), 6.98 - 7.01 (m, 1 H), 7.20 - 7.24 (m, 1 H); ESI MS m/z 343 [M+H]+	1
179		2-[[(5'-フルオロ-2'-メチルビフェニル-4-イル)オキシ]メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.20 (s, 3 H), 2.34 (s, 3 H), 4.17 - 4.40 (m, 4 H), 5.58 - 5.67 (m, 1 H), 6.82 - 7.03 (m, 4 H), 7.12 - 7.34 (m, 3 H); ESI MS m/z 364 [M+H]+	13
180		5-メチル-2-[[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 2.34 (s, 3 H), 4.16 - 4.34 (m, 4 H), 5.56 - 5.61 (m, 1 H), 6.85 - 6.89 (m, 2 H), 7.41 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 366 [M+H]+	36

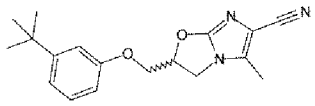
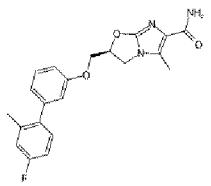
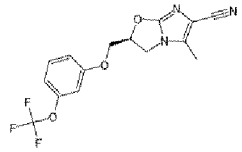
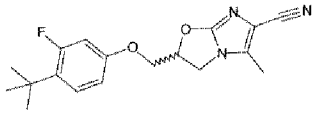
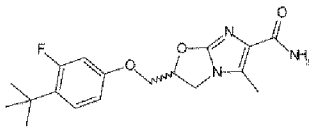
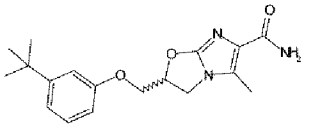
[0220]

[表2-31]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
181		5-メチル-2-[[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 2.53 (s, 3 H), 4.11 - 4.32 (m, 4 H), 5.14 (br. s., 1 H), 5.53 - 5.59 (m, 1 H), 6.73 (br. s., 1 H), 6.86 - 6.91 (m, 2 H), 7.39 - 7.46 (m, 2 H); ESI MS m/z 384 [M+H]+	37
182		(2S)-2-[(3-クロロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 4.18 (dd, J=9.9, 6.6 Hz, 1 H), 4.25 - 4.34 (m, 3 H), 5.56 - 5.62 (m, 1 H), 6.78 (ddd, J=8.3, 2.5, 0.8 Hz, 1 H), 6.90 (t, J=2.5 Hz, 1 H), 7.01 (dt, J=7.0, 0.8 Hz, 1 H), 7.23 (t, J=8.3 Hz, 1 H); ESI MS m/z 290 [M+H]+	5
183		2-[[(5'-フルオロ-2'-メチルビフェニル-4-イル)オキシ]メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.21 (s, 3 H), 2.55 (s, 3 H), 4.16 - 4.40 (m, 4 H), 5.17 (br. s., 1 H), 5.57 - 5.65 (m, 1 H), 6.83 (br. s., 1 H), 6.88 - 6.98 (m, 3 H), 7.17 - 7.28 (m, 4 H); ESI MS m/z 382 [M+H]+	15
184		(2S)-2-[[(4'-フルオロ-2'-メチルビフェニル-3-イル)オキシ]メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.22 - 2.25 (m, 3 H), 2.32 - 2.34 (m, 3 H), 4.21 (dd, J=9.9, 6.2 Hz, 1 H), 4.25 - 4.38 (m, 3 H), 5.57 - 5.63 (m, 1 H), 6.78 - 6.81 (m, 1 H), 6.87 (dd, J=8.1, 2.3 Hz, 1 H), 6.89 - 6.98 (m, 3 H), 7.12 - 7.17 (m, 1 H), 7.33 (t, J=8.1 Hz, 1 H); ESI MS m/z 364 [M+H]+	13
185		2-[(3,4-ジクロロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 4.14 - 4.34 (m, 4 H), 5.56 - 5.61 (m, 1 H), 6.74 - 6.78 (m, 1 H), 6.99 - 7.02 (m, 1 H), 7.35 - 7.38 (m, 1 H); ESI MS m/z 324 [M+H]+	36
186		2-[(2,4-ジクロロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 4.28 - 4.40 (m, 4 H), 5.57 - 5.62 (m, 1 H), 6.87 - 6.90 (m, 1 H), 7.19 - 7.23 (m, 1 H), 7.36 - 7.38 (m, 1 H); ESI MS m/z 324 [M+H]+	36

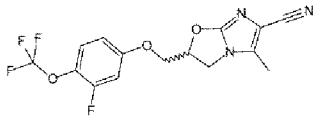
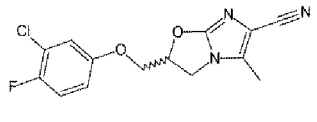
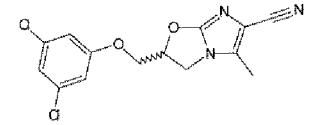
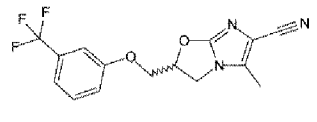
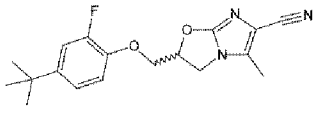
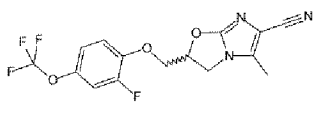
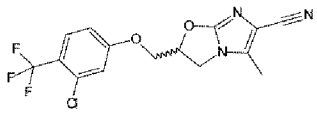
[0221]

[表2-32]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
187		2-[(3-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 2.35 (s, 3 H), 4.19 - 4.32 (m, 4 H), 5.56 - 5.62 (m, 1 H), 6.67 - 6.72 (m, 1 H), 6.90 - 6.93 (m, 1 H), 7.04 - 7.09 (m, 1 H), 7.22 - 7.26 (m, 1 H); ESI MS m/z 312 [M+H]+	36
188		(2S)-2-[[(4'-フルオロ-2'-メチルビフェニル-3-イル)オキシ]メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ ppm 2.23 (s, 3 H), 2.39 (s, 3 H), 4.04 (dd, J=9.7, 6.8 Hz, 1 H), 4.29 - 4.38 (m, 2 H), 4.38 - 4.43 (m, 1 H), 5.62 - 5.68 (m, 1 H), 6.80 (br. s., 1 H), 6.87 - 6.94 (m, 3 H), 6.97 (dd, J=7.8, 2.1 Hz, 1 H), 7.07 (td, J=8.5, 2.9 Hz, 1 H), 7.15 (dd, J=10.1, 2.7 Hz, 1 H), 7.23 (dd, J=8.3, 6.2 Hz, 1 H), 7.36 (t, J=7.8 Hz, 1 H); ESI MS m/z 382 [M+H]+	15
189		(2S)-5-メチル-2-[[3-(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 4.19 (dd, J=9.7, 6.4 Hz, 1 H), 4.26 - 4.36 (m, 3 H), 5.58 - 5.63 (m, 1 H), 6.76 (s, 1 H), 6.83 (dd, J=8.5, 2.3 Hz, 1 H), 6.90 (d, J=8.3 Hz, 1 H), 7.32 (t, J=8.5 Hz, 1 H); ESI MS m/z 340 [M+H]+	5
190		2-[(4-tert-ブチル-3-フルオロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.34 (s, 9 H), 2.34 (s, 3 H), 4.14 - 4.19 (m, 1 H), 4.22 - 4.31 (m, 3 H), 5.54 - 5.60 (m, 1 H), 6.54 - 6.62 (m, 2 H), 7.17 - 7.23 (m, 1 H); ESI MS m/z 330 [M+H]+	36
191		2-[(4-tert-ブチル-3-フルオロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.34 (s, 9 H), 2.52 (s, 3 H), 4.10 - 4.15 (m, 1 H), 4.21 - 4.30 (m, 3 H), 5.16 (br. s., 1 H), 5.50 - 5.57 (m, 1 H), 6.56 - 6.63 (m, 2 H), 6.73 (br. s., 1 H), 7.17 - 7.23 (m, 1 H); ESI MS m/z 348 [M+H]+	37
192		2-[(3-tert-ブチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.30 (s, 9 H), 2.53 (s, 3 H), 4.10 - 4.33 (m, 4 H), 5.14 (br. s., 1 H), 5.53 - 5.59 (m, 1 H), 6.69 - 6.78 (m, 2 H), 6.92 - 6.94 (m, 1 H), 7.03 - 7.07 (m, 1 H), 7.22 - 7.26 (m, 1 H); ESI MS m/z 330 [M+H]+	37

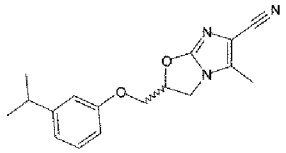
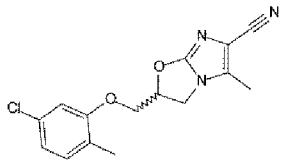
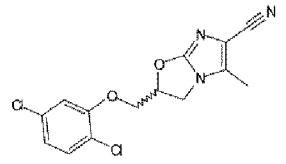
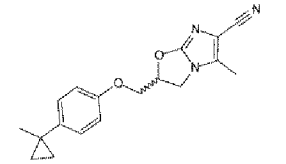
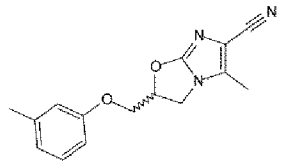
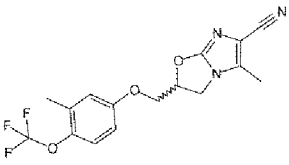
[0222]

[表2-33]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
193		2-[[3-フルオロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 4.15 - 4.35 (m, 4 H), 5.57 - 5.62 (m, 1 H), 6.66 - 6.70 (m, 1 H), 6.73 - 6.78 (m, 1 H), 7.22 - 7.26 (m, 1 H); ESI MS m/z 358 [M+H]+	36
194		2-[(3-クロロ-4-フルオロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) ・ ppm 2.35 (s, 3 H), 4.15 - 4.31 (m, 4 H), 5.54 - 5.60 (m, 1 H), 6.76 (dt, J=9.1, 3.3 Hz, 1 H), 6.94 (dd, J=6.0, 3.1 Hz, 1 H), 7.07 (t, J=8.9 Hz, 1 H); ESI MS m/z 308 [M+H]+	36
195		2-[(3,5-ジクロロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) ・ ppm 2.35 (s, 3 H), 4.10 - 4.36 (m, 4 H), 5.61 - 5.64 (m, 1 H), 6.77 - 6.83 (m, 2 H), 7.00 - 7.07 (m, 1 H); ESI MS m/z 324 [M+H]+	36
196		5-メチル-2-[[3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) ・ ppm 2.36 (s, 3 H), 4.17 - 4.40 (m, 4 H), 5.58 - 5.65 (m, 1 H), 7.07 (dd, J=8.5, 2.3 Hz, 1 H), 7.13 (s, 1 H), 7.29 (d, J=7.8 Hz, 1 H), 7.43 (t, J=8.1 Hz, 1 H); ESI MS m/z 324 [M+H]+	36
197		2-[(4-tert-ブチル-2-フルオロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.28 (s, 9 H), 2.34 (s, 3 H), 4.23 - 4.30 (m, 2 H), 4.31 - 4.38 (m, 2 H), 5.52 - 5.59 (m, 1 H), 6.89 - 6.94 (m, 1 H), 7.04 - 7.14 (m, 2 H); ESI MS m/z 330 [M+H]+	36
198		2-[[2-フルオロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 4.22 - 4.41 (m, 4 H), 5.55 - 5.61 (m, 1 H), 6.96 - 7.05 (m, 3 H); ESI MS m/z 358 [M+H]+	36
199		2-[[3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 4.09 - 4.41 (m, 4 H), 5.58 - 5.64 (m, 1 H), 6.84 - 6.87 (m, 1 H), 7.02 - 7.05 (m, 1 H), 7.61 - 7.65 (m, 1 H); ESI MS m/z 358 [M+H]+	36

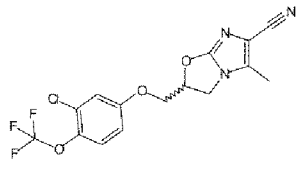
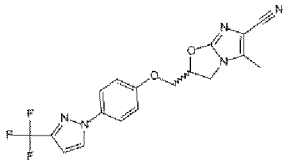
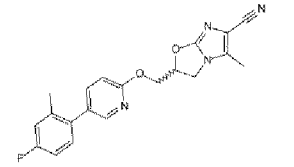
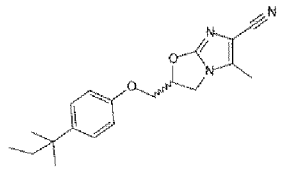
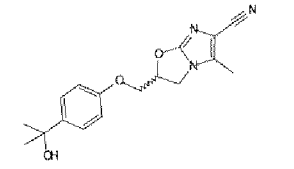
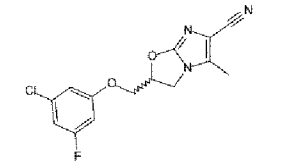
[0223]

[表2-34]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
200		5-メチル-2-{[3-(プロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.24 (d, J=6.6 Hz, 6 H), 2.35 (s, 3 H), 2.83 - 2.92 (m, 1 H), 4.19 - 4.33 (m, 4 H), 5.56 - 5.63 (m, 1 H), 6.67 - 6.72 (m, 1 H), 6.74 - 6.78 (m, 1 H), 6.90 (d, J=7.4 Hz, 1 H), 7.19 - 7.25 (m, 1 H); ESI MS m/z 298 [M+H]+	10
201		2-[(5-クロロ-2-メチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.97 (s, 3 H), 2.35 (s, 3 H), 4.17 - 4.26 (m, 2 H), 4.28 - 4.37 (m, 2 H), 5.59 - 5.66 (m, 1 H), 6.77 (d, J=2.1 Hz, 1 H), 6.90 (dd, J=8.3, 2.1 Hz, 1 H), 7.05 (d, J=8.3 Hz, 1 H); ESI MS m/z 304 [M+H]+	10
202		2-[(2,5-ジクロロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 4.26 - 4.34 (m, 3 H), 4.38 - 4.44 (m, 1 H), 5.57 - 5.65 (m, 1 H), 6.92 - 6.99 (m, 2 H), 7.27 - 7.31 (m, 1 H); ESI MS m/z 324 [M+H]+	10
203		5-メチル-2-{[4-(1-メチルシクロプロピル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.66 - 0.71 (m, 2 H), 0.77 - 0.82 (m, 2 H), 1.36 (s, 3 H), 2.34 (s, 3 H), 4.14 - 4.31 (m, 4 H), 5.52 - 5.60 (m, 1 H), 6.77 - 6.82 (m, 2 H), 7.16 - 7.21 (m, 2 H); ESI MS m/z 310 [M+H]+	10
204		5-メチル-2-[(3-メチルフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.32 - 2.35 (m, 6 H), 4.16 - 4.30 (m, 4 H), 5.54 - 5.60 (m, 1 H), 6.67 - 6.72 (m, 2 H), 6.84 (d, J=7.4 Hz, 1 H), 7.18 (t, J=7.8 Hz, 1 H); ESI MS m/z 270 [M+H]+	10
205		5-メチル-2-{[3-メチル-4-(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.29 (s, 3 H), 2.35 (s, 3 H), 4.15 - 4.32 (m, 4 H), 5.55 - 5.60 (m, 1 H), 6.69 - 6.72 (m, 1 H), 6.75 - 6.77 (m, 1 H), 7.12 - 7.15 (m, 1 H); ESI MS m/z 354 [M+H]+	10

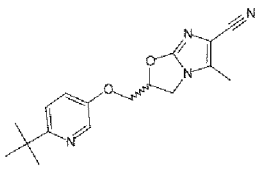
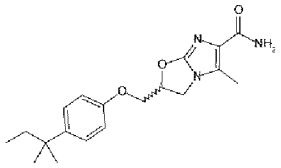
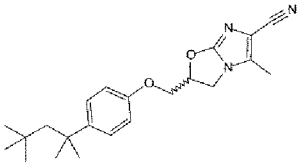
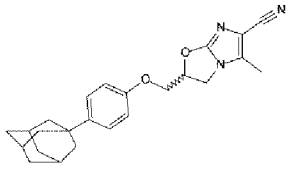
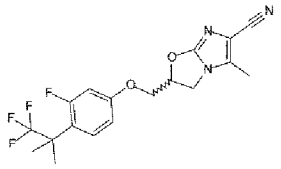
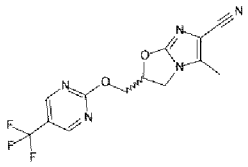
[0224]

[表2-35]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
206		2-{[3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 4.10 - 4.35 (m, 4 H), 5.57 - 5.62 (m, 1 H), 6.80 - 6.83 (m, 1 H), 7.00 - 7.02 (m, 1 H), 7.25 - 7.28 (m, 1 H); ESI MS m/z 374 [M+H]+	10
207		5-メチル-2-({4-[3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 4.19 - 4.40 (m, 4 H), 5.58 - 5.64 (m, 1 H), 6.71 (d, J=2.5 Hz, 1 H), 6.97 - 7.01 (m, 2 H), 7.61 - 7.65 (m, 2 H), 7.85 - 7.88 (m, 1 H); ESI MS m/z 390 [M+H]+	10
208		2-({[5-(4-フルオロ-2-メチルフェニル)ピリジン-2-イル]オキシ}メチル)-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.24 (s, 3 H), 2.34 (s, 3 H), 4.10 - 4.16 (m, 1 H), 4.24 - 4.29 (m, 1 H), 4.69 - 4.76 (m, 2 H), 5.63 - 5.69 (m, 1 H), 6.80 - 6.82 (m, 1 H), 6.95 (td, J=8.4, 2.7 Hz, 1 H), 7.00 (dd, J=9.7, 2.7 Hz, 1 H), 7.13 (dd, J=8.5, 6.0 Hz, 1 H), 7.56 (dd, J=8.5, 2.3 Hz, 1 H), 8.04 - 8.06 (m, 1 H); ESI MS m/z 365 [M+H]+	13
209		5-メチル-2-{[4-(2-メチルブタン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.66 (t, J=7.4 Hz, 3 H), 1.25 (s, 6 H), 1.61 (q, J=7.4 Hz, 2 H), 2.34 (s, 3 H), 4.16 - 4.31 (m, 4 H), 5.54 - 5.60 (m, 1 H), 6.80 - 6.85 (m, 2 H), 7.21 - 7.28 (m, 2 H); ESI MS m/z 326 [M+H]+	10
210		2-{[4-(2-ヒドロキシプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.57 (s, 6 H), 2.34 (s, 3 H), 4.17 - 4.32 (m, 4 H), 5.55 - 5.60 (m, 1 H), 6.84 - 6.87 (m, 2 H), 7.42 - 7.44 (m, 2 H); ESI MS m/z 336 [M+Na]+	38
211		2-[(3-クロロ-5-フルオロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 4.16 (dd, J=9.7, 6.4 Hz, 1 H), 4.24 - 4.34 (m, 3 H), 5.55 - 5.61 (m, 1 H), 6.53 (dt, J=9.9, 2.3 Hz, 1 H), 6.71 (s, 1 H), 6.78 (dt, J=8.3, 2.1 Hz, 1 H); ESI MS m/z 308 [M+H]+	10

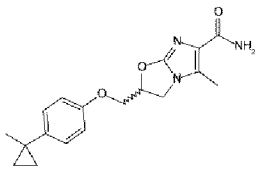
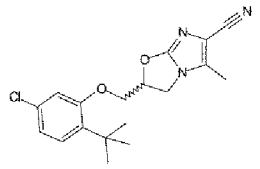
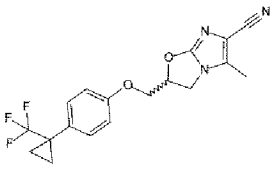
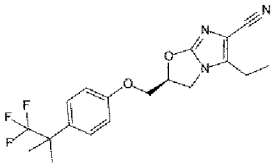
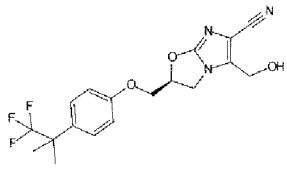
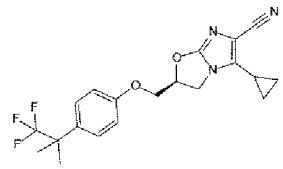
[0225]

[表2-36]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
212		2-{[(6-tert-ブチルピリジン-3-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.34 (s, 9 H), 2.35 (s, 3 H), 4.19 (dd, J=9.7, 6.4 Hz, 1 H), 4.25 - 4.30 (m, 1 H), 4.31 - 4.38 (m, 2 H), 5.57 - 5.62 (m, 1 H), 7.15 (dd, J=8.9, 3.1 Hz, 1 H), 7.28 (d, J=8.7 Hz, 1 H), 8.25 (d, J=3.3 Hz, 1 H); ESI MS m/z 313 [M+H]+	10
213		5-メチル-2-{[4-(2-メチルブタン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.66 (t, J=7.4 Hz, 3 H), 1.25 (s, 6 H), 1.58 - 1.64 (m, 2 H), 2.52 (s, 3 H), 4.12 - 4.17 (m, 1 H), 4.21 - 4.31 (m, 3 H), 5.19 (br. s., 1 H), 5.51 - 5.57 (m, 1 H), 6.72 (br. s., 1 H), 6.81 - 6.85 (m, 2 H), 7.23 - 7.27 (m, 2 H); ESI MS m/z 344 [M+H]+	15
214		5-メチル-2-{[4-(2,4,4-トリメチルペンタン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.71 (s, 9 H), 1.34 (s, 6 H), 1.70 (s, 2 H), 2.34 (s, 3 H), 4.17 - 4.30 (m, 4 H), 5.54 - 5.61 (m, 1 H), 6.78 - 6.82 (m, 2 H), 7.27 - 7.31 (m, 2 H); ESI MS m/z 368 [M+H]+	10
215		5-メチル-2-{[4-(トリシクロ[3.3.1.13,7]デカ-1-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.71 - 1.82 (m, 6 H), 1.86 - 1.89 (m, 6 H), 2.09 (br. s., 3 H), 2.34 (s, 3 H), 4.15 - 4.20 (m, 1 H), 4.22 - 4.31 (m, 3 H), 5.54 - 5.60 (m, 1 H), 6.82 - 6.86 (m, 2 H), 7.27 - 7.32 (m, 2 H); ESI MS m/z 390 [M+H]+	10
216		2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.58 - 1.65 (m, 6 H), 2.35 (s, 3 H), 4.13 - 4.20 (m, 1 H), 4.23 - 4.35 (m, 3 H), 5.55 - 5.62 (m, 1 H), 6.58 - 6.71 (m, 2 H), 7.34 (t, J=9.1 Hz, 1 H); ESI MS m/z 384 [M+H]+	10
217		5-メチル-2-({[5-(トリフルオロメチル)ピリミジン-2-イル]オキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.34 (s, 3 H), 4.17 - 4.25 (m, 1 H), 4.27 - 4.35 (m, 1 H), 4.70 - 4.78 (m, 1 H), 4.85 - 4.93 (m, 1 H), 5.62 - 5.71 (m, 1 H), 8.80 (s, 2 H); ESI MS m/z 326 [M+H]+	39

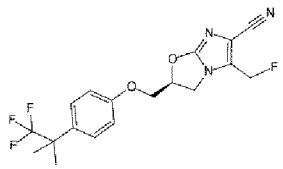
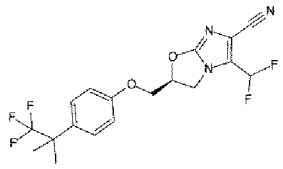
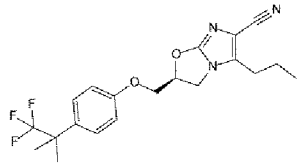
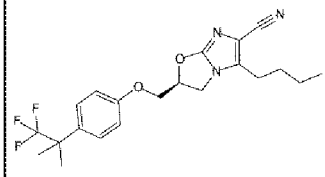
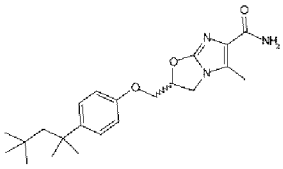
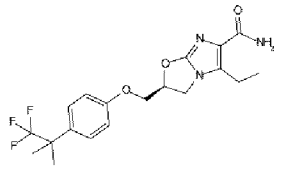
[0226]

[表2-37]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
218		5-メチル-2-{[4-(1-メチルシクロプロピル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.67 - 0.70 (m, 2 H), 0.77 - 0.81 (m, 2 H), 1.36 (s, 3 H), 2.52 (s, 3 H), 4.10 - 4.28 (m, 4 H), 5.13 (br. s., 1 H), 5.50 - 5.57 (m, 1 H), 6.71 (br. s., 1 H), 6.79 - 6.83 (m, 2 H), 7.17 - 7.21 (m, 2 H); ESI MS m/z 328 [M+H]+	40
219		2-[(2-tert-ブチル-5-クロロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.20 (s, 9 H), 2.34 (s, 3 H), 4.19 - 4.41 (m, 4 H), 5.65 - 5.70 (m, 1 H), 6.81 - 6.83 (m, 1 H), 6.93 - 6.96 (m, 1 H), 7.20 - 7.23 (m, 1 H); ESI MS m/z 346 [M+H]+	10
220		5-メチル-2-({4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.96 - 1.00 (m, 2 H), 1.31 - 1.34 (m, 2 H), 2.34 (s, 3 H), 4.15 - 4.33 (m, 4 H), 5.56 - 5.61 (m, 1 H), 6.84 - 6.87 (m, 2 H), 7.40 (d, J=8.7 Hz, 2 H); ESI MS m/z 364 [M+H]+	10
221		(2S)-5-エチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (t, J=7.6 Hz, 3 H), 1.55 (s, 6 H), 2.73 (q, J=7.6 Hz, 2 H), 4.18 - 4.21 (m, 1 H), 4.27 - 4.34 (m, 3 H), 5.55 - 5.60 (m, 1 H), 6.85 - 6.88 (m, 2 H), 7.41 - 7.44 (m, 2 H); ESI MS m/z 380 [M+H]+	3
222		(2S)-5-(ヒドロキシメチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 2.24 - 2.28 (m, 1 H), 4.30 - 4.36 (m, 3 H), 4.41 - 4.45 (m, 1 H), 4.70 - 4.73 (m, 2 H), 5.60 - 5.65 (m, 1 H), 6.86 - 6.89 (m, 2 H), 7.41 - 7.44 (m, 2 H); ESI MS m/z 382 [M+H]+	24
223		(2S)-5-シクロプロピル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.92 - 0.96 (m, 2 H), 1.02 - 1.07 (m, 2 H), 1.55 (s, 6 H), 1.75 - 1.81 (m, 1 H), 4.17 - 4.22 (m, 1 H), 4.26 - 4.34 (m, 3 H), 5.54 - 5.60 (m, 1 H), 6.85 - 6.89 (m, 2 H), 7.41 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 392 [M+H]+	49

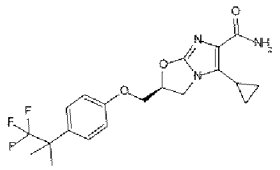
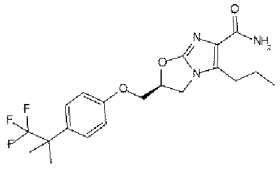
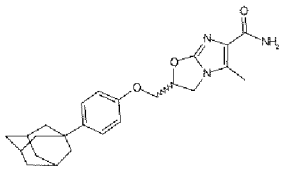
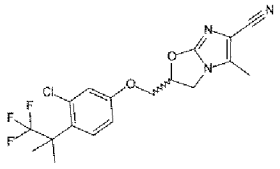
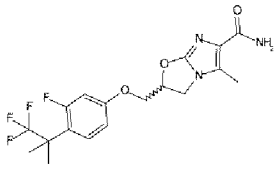
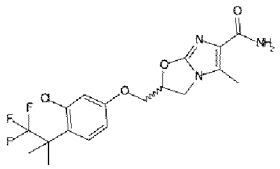
[0227]

[表2-38]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
224		(2S)-5-(フルオロメチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 4.28 - 4.43 (m, 4 H), 5.33 - 5.43 (m, 2 H), 5.63 - 5.68 (m, 1 H), 6.85 - 6.89 (m, 2 H), 7.41 - 7.44 (m, 2 H); ESI MS m/z 384 [M+H]+	41
225		(2S)-5-(ジフルオロメチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 4.28 - 4.51 (m, 4 H), 5.67 - 5.71 (m, 1 H), 6.69 - 6.88 (m, 3 H), 7.41 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 402 [M+H]+	61
226		(2S)-5-プロピル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.99 - 1.03 (m, 3 H), 1.55 (s, 6 H), 1.64 - 1.72 (m, 2 H), 2.62 - 2.71 (m, 2 H), 4.16 - 4.20 (m, 1 H), 4.25 - 4.34 (m, 3 H), 5.55 - 5.60 (m, 1 H), 6.84 - 6.88 (m, 2 H), 7.41 - 7.44 (m, 2 H); ESI MS m/z 394 [M+H]+	3
227		(2S)-5-ブチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.93 - 0.98 (m, 3 H), 1.37 - 1.44 (m, 2 H), 1.55 (s, 6 H), 1.59 - 1.65 (m, 2 H), 2.64 - 2.73 (m, 2 H), 4.16 - 4.20 (m, 1 H), 4.25 - 4.34 (m, 3 H), 5.55 - 5.60 (m, 1 H), 6.84 - 6.88 (m, 2 H), 7.40 - 7.44 (m, 2 H); ESI MS m/z 408 [M+H]+	3
228		5-メチル-2-{[4-(2,4,4-トリメチルペンタン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.71 (s, 9 H), 1.34 (s, 6 H), 1.70 (s, 2 H), 2.53 (s, 3 H), 4.15 - 4.20 (m, 1 H), 4.22 - 4.30 (m, 3 H), 5.15 (br. s, 1 H), 5.52 - 5.60 (m, 1 H), 6.79 - 6.83 (m, 3 H), 7.27 - 7.31 (m, 2 H); ESI MS m/z 386 [M+H]+	40
229		(2S)-5-エチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.21 - 1.25 (m, 3 H), 1.55 (s, 6 H), 3.00 - 3.06 (m, 2 H), 4.15 - 4.19 (m, 1 H), 4.26 - 4.33 (m, 3 H), 5.16 (br. s., 1 H), 5.52 - 5.57 (m, 1 H), 6.75 (br. s., 1 H), 6.86 - 6.90 (m, 2 H), 7.41 - 7.44 (m, 2 H); ESI MS m/z 398 [M+H]+	40

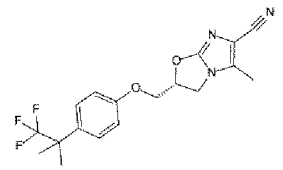
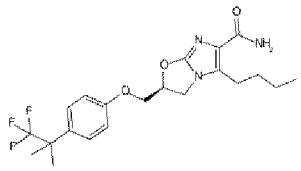
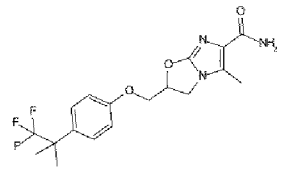
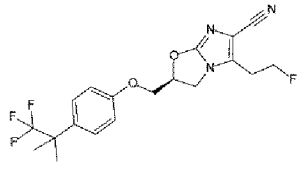
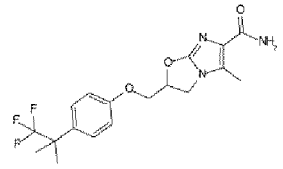
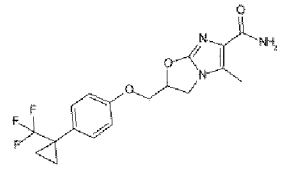
[0228]

[表2-39]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
230		(2S)-5-シクロプロピル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.80 - 0.84 (m, 2 H), 1.03 - 1.07 (m, 2 H), 1.54 - 1.56 (m, 6 H), 2.67 - 2.73 (m, 1 H), 4.07 - 4.12 (m, 1 H), 4.19 - 4.31 (m, 3 H), 5.16 (br. s., 1 H), 5.47 - 5.52 (m, 1 H), 6.75 (br. s., 1 H), 6.85 - 6.90 (m, 2 H), 7.40 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 410 [M+H]+	40
231		(2S)-5-プロピル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.96 - 1.00 (m, 3 H), 1.55 (s, 6 H), 1.62 - 1.69 (m, 2 H), 2.91 - 3.02 (m, 2 H), 4.14 - 4.18 (m, 1 H), 4.24 - 4.33 (m, 3 H), 5.13 (br. s., 1 H), 5.52 - 5.57 (m, 1 H), 6.75 (br. s., 1 H), 6.86 - 6.90 (m, 2 H), 7.40 - 7.44 (m, 2 H); ESI MS m/z 412 [M+H]+	40
232		5-メチル-2-{[4-(トリシクロ[3.3.1.13,7]デカ-1-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.70 - 1.81 (m, 6 H), 1.88 (m, J=2.5 Hz, 6 H), 2.09 (m, J=3.3 Hz, 3 H), 2.52 (s, 3 H), 4.11 - 4.17 (m, 1 H), 4.21 - 4.31 (m, 3 H), 5.16 (br. s., 1 H), 5.52 - 5.59 (m, 1 H), 6.78 (br. s, 1 H), 6.83 - 6.87 (m, 2 H), 7.27 - 7.31 (m, 2 H); ESI MS m/z 408 [M+H]+	15
233		2-{[3-クロロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.74 (s, 6 H), 2.34 (s, 3 H), 4.12 - 4.20 (m, 1 H), 4.23 - 4.36 (m, 3 H), 5.53 - 5.64 (m, 1 H), 6.78 (dd, J=8.7, 2.9 Hz, 1 H), 6.95 (d, J=2.9 Hz, 1 H), 7.46 (d, J=8.7 Hz, 1 H); ESI MS m/z 400 [M+H]+	10
234		2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.62 (s, 6 H), 2.53 (s, 3 H), 4.08 - 4.16 (m, 1 H), 4.21 - 4.34 (m, 3 H), 5.18 (br. s., 1 H), 5.51 - 5.60 (m, 1 H), 6.57 - 6.78 (m, 3 H), 7.30 - 7.37 (m, 1 H); ESI MS m/z 402 [M+H]+	15
235		2-{[3-クロロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.74 (s, 6 H), 2.53 (s, 3 H), 4.10 - 4.15 (m, 1 H), 4.22 - 4.33 (m, 3 H), 5.16 (br. s, 1 H), 5.51 - 5.58 (m, 1 H), 6.69 - 6.81 (m., 2 H), 6.96 (d, J=2.9 Hz, 1 H), 7.46 (d, J=8.7 Hz, 1 H); ESI MS m/z 418 [M+H]+	15

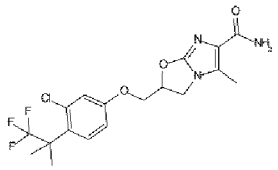
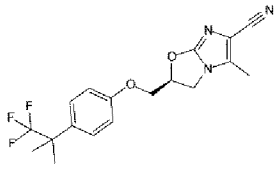
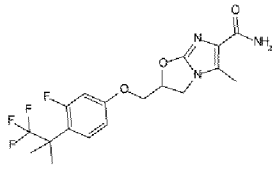
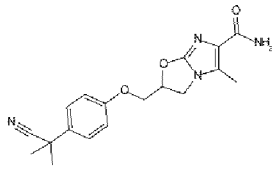
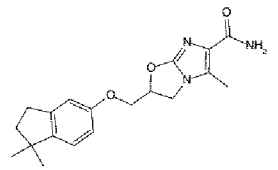
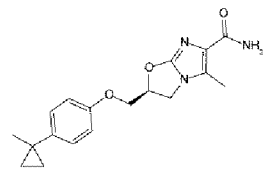
[0229]

[表2-40]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
236		(2R)-5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 2.34 (s, 3 H), 4.16 - 4.20 (m, 1 H), 4.24 - 4.34 (m, 3 H), 5.56 - 5.61 (m, 1 H), 6.85 - 6.89 (m, 2 H), 7.41 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 366 [M+H]+	1
237		(2S)-5-ブチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.91 - 0.95 (m, 3 H), 1.35 - 1.43 (m, 2 H), 1.55 (s, 6 H), 1.56 - 1.62 (m, 2 H), 2.94 - 3.03 (m, 2 H), 4.13 - 4.17 (m, 1 H), 4.25 - 4.33 (m, 3 H), 5.17 (br. s., 1 H), 5.52 - 5.56 (m, 1 H), 6.75 (br. s., 1 H), 6.86 - 6.89 (m, 2 H), 7.40 - 7.44 (m, 2 H); ESI MS m/z 426 [M+H]+	40
238		5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 2.53 (s, 3 H), 4.12 - 4.17 (m, 1 H), 4.23 - 4.31 (m, 3 H), 5.14 (br. s, 1 H), 5.53 - 5.58 (m, 1 H), 6.73 (br. s, 1 H), 6.87 - 6.90 (m, 2 H), 7.41 - 7.44 (m, 2 H); ESI MS m/z 384 [M+H]+	42
239		(2S)-5-(2-フルオロエチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 3.02 - 3.15 (m, 2 H), 4.21 - 4.38 (m, 4 H), 4.59 - 4.75 (m, 2 H), 5.53 - 5.61 (m, 1 H), 6.84 - 6.90 (m, 2 H), 7.39 - 7.46 (m, 2 H); ESI MS m/z 398 [M+H]+	41
240		5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド		42
241		5-メチル-2-({4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.94 - 1.01 (m, 2 H), 1.30 - 1.35 (m, 2 H), 2.52 (s, 3 H), 4.09 - 4.17 (m, 1 H), 4.21 - 4.33 (m, 3 H), 5.14 (br. s., 1 H), 5.51 - 5.59 (m, 1 H), 6.72 (br. s., 1 H), 6.83 - 6.89 (m, 2 H), 7.36 - 7.42 (m, 2 H); ESI MS m/z 382 [M+H]+	43

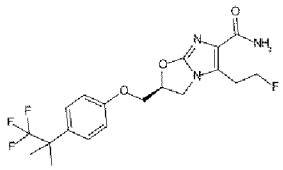
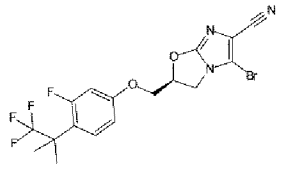
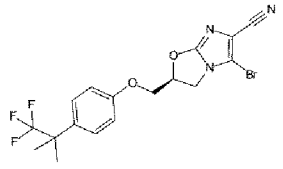
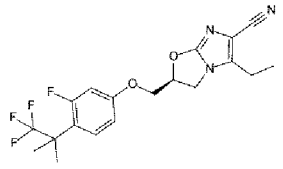
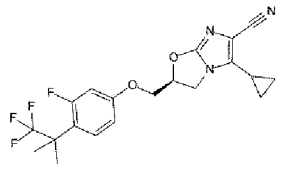
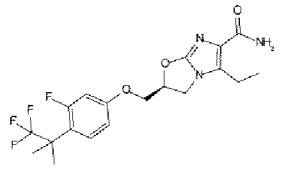
[0230]

[表2-41]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
242		2-{[3-クロロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド		44
243		(2S)-5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) d ppm 1.55 (6 H, br. s.), 2.35 (3 H, s), 4.15 - 4.35 (4 H, m), 5.54 - 5.64 (1 H, m), 6.82 - 6.92 (2 H, m), 7.40 - 7.47 (2 H, m); ESI MS m/z 366 [M+H]+	48
244		2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド		45
245		2-{[4-(2-シアノプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.70 (s, 6 H), 2.53 (s, 3 H), 4.11 - 4.19 (m, 1 H), 4.23 - 4.36 (m, 3 H), 5.17 (br. s., 1 H), 5.52 - 5.60 (m, 1 H), 6.74 (br. s., 1 H), 6.88 - 6.94 (m, 2 H), 7.37 - 7.43 (m, 2 H); ESI MS m/z 341 [M+H]+	46
246		2-{[(1,1-ジメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.23 (s, 6 H), 1.89 - 1.96 (m, 2 H), 2.52 (s, 3 H), 2.85 (t, J=7.2 Hz, 2 H), 4.10 - 4.16 (m, 1 H), 4.19 - 4.31 (m, 3 H), 5.14 (br. s., 1 H), 5.49 - 5.57 (m, 1 H), 6.68 - 6.77 (m, 3 H), 7.01 - 7.06 (m, 1 H); ESI MS m/z 342 [M+H]+	47
247		(2S)-5-メチル-2-{[4-(1-メチルシクロプロピル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド		10

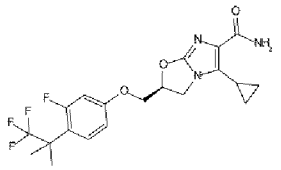
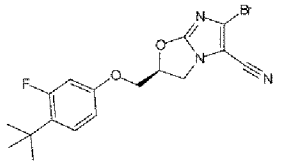
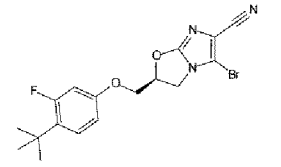
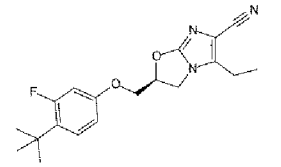
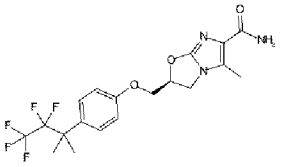
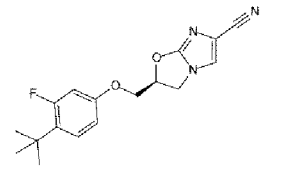
[0231]

[表2-42]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
248		(2S)-5-(2-フルオロエチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 3.29 - 3.48 (m, 2 H), 4.16 - 4.36 (m, 4 H), 4.62 - 4.78 (m, 2 H), 5.25 (br. s., 1 H), 5.50 - 5.58 (m, 1 H), 6.79 (br. s., 1 H), 6.85 - 6.91 (m, 2 H), 7.37 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 416 [M+H]+	40
249		(2S)-5-ブロモ-2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.62 (s, 6 H), 4.21 - 4.43 (m, 4 H), 5.59 - 5.67 (m, 1 H), 6.55 - 6.74 (m, 2 H), 7.30 - 7.40 (m, 1 H); ESI MS m/z 448 [M+H]+	48
250		(2S)-5-ブロモ-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.56 (s, 6 H), 4.24 - 4.43 (m, 4 H), 5.60 - 5.67 (m, 1 H), 6.84 - 6.90 (m, 2 H), 7.39 - 7.46 (m, 2 H); ESI MS m/z 430 [M+H]+	48
251		(2S)-5-エチル-2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (t, J=7.4 Hz, 3 H), 1.61 (s, 6 H), 2.72 (q, J=7.4 Hz, 2 H), 4.15 - 4.21 (m, 1 H), 4.24 - 4.36 (m, 3 H), 5.55 - 5.62 (m, 1 H), 6.57 - 6.69 (m, 2 H), 7.33 (t, J=8.9 Hz, 1 H); ESI MS m/z 398 [M+H]+	3
252		(2S)-5-シクロプロピル-2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.89 - 0.97 (m, 2 H), 1.01 - 1.08 (m, 2 H), 1.62 (s, 6 H), 1.74 - 1.82 (m, 1 H), 4.14 - 4.20 (m, 1 H), 4.23 - 4.35 (m, 3 H), 5.53 - 5.61 (m, 1 H), 6.58 - 6.70 (m, 2 H), 7.34 (t, J=9.1 Hz, 1 H); ESI MS m/z 410 [M+H]+	49
253		(2S)-5-エチル-2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.19 - 1.25 (m, 3 H), 1.61 (s, 6 H), 2.98 - 3.07 (m, 2 H), 4.11 - 4.18 (m, 1 H), 4.23 - 4.34 (m, 3 H), 5.40 (br. s., 1 H), 5.50 - 5.59 (m, 1 H), 6.57 - 6.71 (m, 2 H), 6.79 (br. s., 1 H), 7.29 - 7.37 (m, 1 H); ESI MS m/z 416 [M+H]+	40

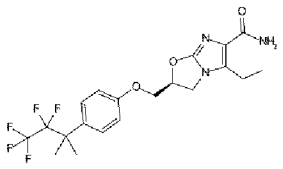
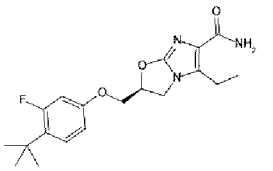
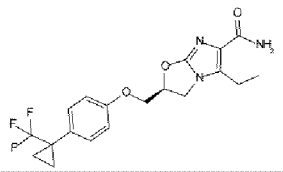
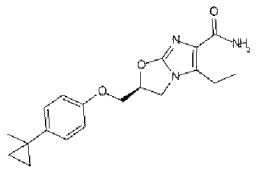
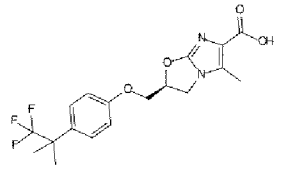
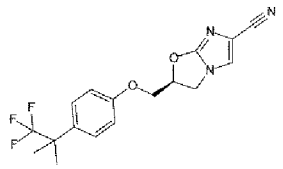
[0232]

[表2-43]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
254		(2S)-5-シクロプロピル-2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.76 - 0.86 (m, 2 H), 0.99 - 1.08 (m, 2 H), 1.61 (s, 6 H), 2.64 - 2.74 (m, 1 H), 4.01 - 4.11 (m, 1 H), 4.15 - 4.31 (m, 3 H), 5.34 - 5.54 (m, 2 H), 6.54 - 6.70 (m, 2 H), 6.79 (br. s., 1 H), 7.33 (t, J=8.9 Hz, 1 H); ESI MS m/z 428 [M+H]+	40
255		(2S)-6-ブロモ-2-[(4-tert-ブチル-3-フルオロフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.34 (s, 9 H), 4.23 - 4.28 (m, 1 H), 4.33 - 4.38 (m, 2 H), 4.39 - 4.45 (m, 1 H), 5.62 - 5.68 (m, 1 H), 6.55 - 6.64 (m, 2 H), 7.18 - 7.23 (m, 1 H); ESI MS m/z 394 [M+H]+	48
256		(2S)-5-ブロモ-2-[(4-tert-ブチル-3-フルオロフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.35 (s, 9 H), 4.21 - 4.40 (m, 4 H), 5.58 - 5.66 (m, 1 H), 6.54 - 6.64 (m, 2 H), 7.16 - 7.25 (m, 1 H); ESI MS m/z 394 [M+H]+	48
257		(2S)-2-[(4-tert-ブチル-3-フルオロフェノキシ)メチル]-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.29 (t, J=7.4 Hz, 3 H), 1.34 (s, 9 H), 2.73 (q, J=7.4 Hz, 2 H), 4.15 - 4.33 (m, 4 H), 5.53 - 5.62 (m, 1 H), 6.52 - 6.65 (m, 2 H), 7.15 - 7.25 (m, 1 H); ESI MS m/z 344 [M+H]+	50
258		(2S)-5-メチル-2-{[4-(3,3,4,4,4-ペンタフルオロ-2-メチルブタン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.58 (s, 6 H), 2.53 (s, 3 H), 4.09 - 4.19 (m, 1 H), 4.23 - 4.35 (m, 3 H), 5.14 (br. s, 1 H), 5.52 - 5.60 (m, 1 H), 6.75 (br. s, 1 H), 6.84 - 6.90 (m, 2 H), 7.37 - 7.44 (m, 2 H); ESI MS m/z 434 [M+H]+	10
259		(2S)-2-[(4-tert-ブチル-3-フルオロフェノキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.34 (s, 9 H), 4.22 - 4.40 (m, 4 H), 5.55 - 5.63 (m, 1 H), 6.53 - 6.62 (m, 2 H), 7.17 - 7.24 (m, 2 H); ESI MS m/z 316 [M+H]+	50

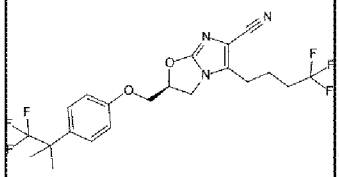
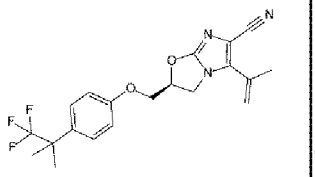
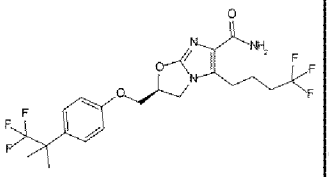
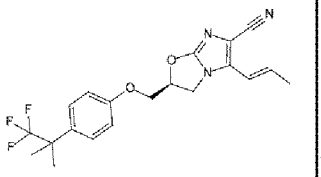
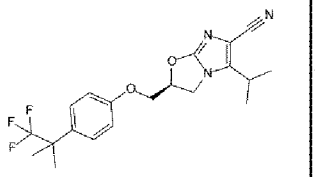
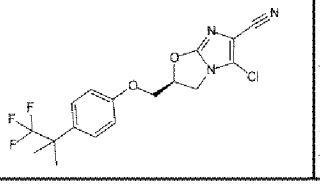
[0233]

[表2-44]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
260		(2S)-5-エチル-2-{[4-(3,3,4,4,4-ペンタフルオロ-2-メチルブタン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.20 - 1.25 (m, 3 H), 1.58 (s, 6 H), 2.99 - 3.07 (m, 2 H), 4.16 - 4.21 (m, 1 H), 4.26 - 4.34 (m, 3 H), 5.14 (br. s., 1 H), 5.52 - 5.58 (m, 1 H), 6.75 (br. s., 1 H), 6.84 - 6.89 (m, 2 H), 7.38 - 7.43 (m, 2 H); ESI MS m/z 448 [M+H]+	10
261		(2S)-2-[(4-tert-ブチル-3-フルオロフェノキシ)メチル]-5-エチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.20 - 1.25 (m, 3 H), 1.34 (s, 9 H), 2.98 - 3.09 (m, 2 H), 4.12 - 4.18 (m, 1 H), 4.21 - 4.32 (m, 3 H), 5.13 (br. s, 1 H), 5.50 - 5.59 (m, 1 H), 6.55 - 6.63 (m, 2 H), 6.75 (br. s, 1 H), 7.17 - 7.23 (m, 1 H); ESI MS m/z 362 [M+H]+	40
262		(2S)-5-エチル-2-({4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.96 - 1.00 (m, 2 H), 1.21 - 1.25 (m, 3 H), 1.30 - 1.34 (m, 2 H), 3.00 - 3.07 (m, 2 H), 4.15 - 4.19 (m, 1 H), 4.26 - 4.33 (m, 3 H), 5.14 (br. s, 1 H), 5.53 - 5.59 (m, 1 H), 6.78 (br. s, 1 H), 6.84 - 6.87 (m, 2 H), 7.37 - 7.41 (m, 2 H); ESI MS m/z 396 [M+H]+	10
263		(2S)-5-エチル-2-{[4-(1-メチルシクロプロピル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.68 - 0.70 (m, 2 H), 0.78 - 0.80 (m, 2 H), 1.22 (t, J=7.4 Hz, 3 H), 1.36 (s, 3 H), 3.00 - 3.05 (m, 2 H), 4.14 - 4.19 (m, 1 H), 4.25 - 4.29 (m, 3 H), 5.12 (br. s., 1 H), 5.50 - 5.56 (m, 1 H), 6.74 (br. s, 1 H), 6.79 - 6.82 (m, 2 H), 7.17 - 7.21 (m, 2 H); ESI MS m/z 342 [M+H]+	10
264		(2S)-5-メチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボン酸	1H NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ ppm 1.52 (s, 6 H), 2.40 (s, 3 H), 4.07 - 4.12 (m, 1 H), 4.33 - 4.41 (m, 3 H), 5.69 - 5.75 (m, 1 H), 6.96 - 6.99 (m, 2 H), 7.46 (d, J=8.7 Hz, 2 H); ESI MS m/z 385 [M+H]+	51
265		(2S)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 4.26 - 4.40 (m, 4 H), 5.57 - 5.64 (m, 1 H), 6.84 - 6.89 (m, 2 H), 7.23 (s, 1 H), 7.39 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 352 [M+H]+	7

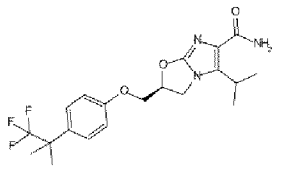
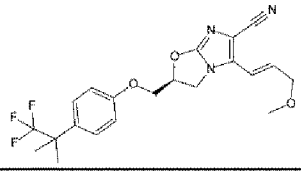
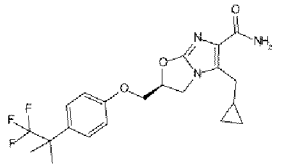
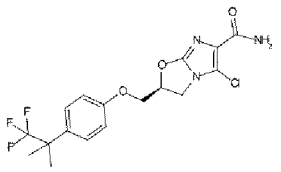
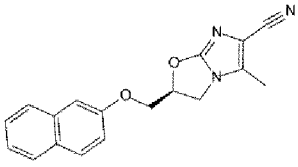
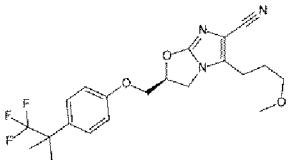
[0234]

[表2-45]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
266		(2S)-5-(4,4,4-トリフルオロブチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 1.88 - 1.99 (m, 2 H), 2.14 - 2.26 (m, 2 H), 2.76 - 2.84 (m, 2 H), 4.18 - 4.39 (m, 4 H), 5.57 - 5.64 (m, 1 H), 6.82 - 6.89 (m, 2 H), 7.39 - 7.46 (m, 2 H); ESI MS m/z 462 [M+H]+	3
267		(2S)-5-(プロパ-1-エン-2-イル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.51 - 1.56 (m, 6 H), 2.25 (s, 3 H), 4.27 - 4.47 (m, 4 H), 5.20 - 5.25 (m, 1 H), 5.29 - 5.34 (m, 1 H), 5.56 - 5.64 (m, 1 H), 6.85 - 6.91 (m, 2 H), 7.39 - 7.47 (m, 2 H); ESI MS m/z 392 [M+H]+	4
268		(2S)-5-(4,4,4-トリフルオロブチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.56 (s., 6 H), 1.83 - 1.94 (m, 2 H), 2.13 - 2.26 (m, 2 H), 3.03 - 3.13 (m, 2 H), 4.13 - 4.38 (m, 4 H), 5.18 (br. s., 1 H), 5.53 - 5.61 (m, 1 H), 6.76 (br. s., 1 H), 6.84 - 6.90 (m, 2 H), 7.38 - 7.46 (m, 2 H); ESI MS m/z 480 [M+H]+	40
269		(2S)-5-[(1E)-プロパ-1-エン-1-イル]-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 1.89 - 1.97 (m, 3 H), 4.25 - 4.44 (m, 4 H), 5.57 - 5.65 (m, 1 H), 6.11 - 6.20 (m, 1 H), 6.28 - 6.35 (m, 1 H), 6.84 - 6.90 (m, 2 H), 7.39 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 392 [M+H]+	52
270		(2S)-5-(プロパン-2-イル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.32 - 1.36 (m, 6 H), 1.55 (s, 6 H), 3.11 - 3.20 (m, 1 H), 4.20 - 4.39 (m, 4 H), 5.53 - 5.60 (m, 1 H), 6.83 - 6.90 (m, 2 H), 7.40 - 7.46 (m, 2 H); ESI MS m/z 394 [M+H]+	27
271		(2S)-5-クロロ-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 4.27 - 4.39 (m, 4 H), 5.60 - 5.66 (m, 1 H), 6.85 - 6.90 (m, 2 H), 7.41 - 7.46 (m, 2 H); ESI MS m/z 386 [M+H]+	2

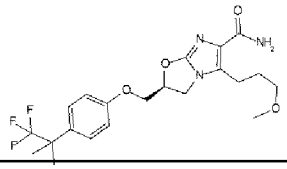
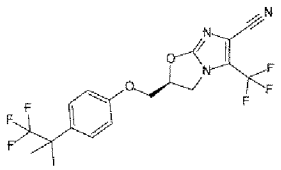
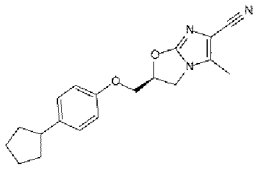
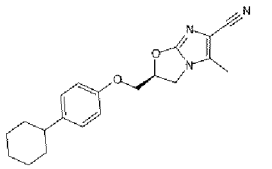
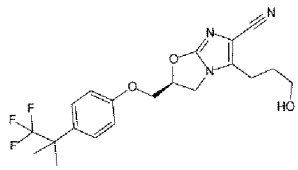
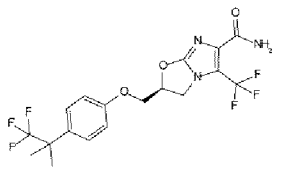
[0235]

[表2-46]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
272		(2S)-5-(プロパン-2-イル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.24 - 1.28 (m, 6 H), 1.55 (s, 6 H), 4.13 - 4.40 (m, 5 H), 5.19 (br. s., 1 H), 5.48 - 5.55 (m, 1 H), 6.79 (br. s., 1 H), 6.85 - 6.92 (m, 2 H), 7.40 - 7.46 (m, 2 H); ESI MS m/z 412 [M+H]+	40
273		(2S)-5-{(1E)-3-メトキシプロパ-1-エン-1-イル}-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 3.40 (s, 3 H), 4.10 (dd, J=5.4, 1.7 Hz, 2 H), 4.26 - 4.47 (m, 4 H), 5.60 - 5.67 (m, 1 H), 6.17 (dt, J=16.1, 5.4 Hz, 1 H), 6.56 (dt, J=16.1, 1.7 Hz, 1 H), 6.84 - 6.90 (m, 2 H), 7.39 - 7.46 (m, 2 H); ESI MS m/z 422 [M+H]+	4
274		(2S)-5-(シクロプロピルメチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.25 - 0.29 (m, 2 H), 0.51 - 0.55 (m, 2 H), 0.93 - 0.99 (m, 1 H), 1.55 (s, 6 H), 2.94 - 3.03 (m, 2 H), 4.22 - 4.39 (m, 4 H), 5.14 (br. s., 1 H), 5.53 - 5.58 (m, 1 H), 6.76 - 6.82 (m, 1 H), 6.86 - 6.90 (m, 2 H), 7.42 (d, J=8.7 Hz, 2 H); ESI MS m/z 424 [M+H]+	3, 40
275		(2S)-5-クロロ-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 4.23 - 4.38 (m, 4 H), 5.36 (br. s., 1 H), 5.57 - 5.63 (m, 1 H), 6.70 (br. s., 1 H), 6.86 - 6.91 (m, 2 H), 7.40 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 404 [M+H]+	40
276		(2S)-5-メチル-2-[(ナフタレン-2-イルオキシ)メチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 4.20 - 4.33 (m, 2 H), 4.39 - 4.47 (m, 2 H), 5.61 - 5.69 (m, 1 H), 7.08 - 7.17 (m, 2 H), 7.36 - 7.41 (m, 1 H), 7.44 - 7.50 (m, 1 H), 7.70 - 7.81 (m, 3 H); ESI MS m/z 306 [M+H]+	10
277		(2S)-5-(3-メトキシプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 1.88 - 1.95 (m, 2 H), 2.76 - 2.81 (m, 2 H), 3.32 (s, 3 H), 3.41 (t, J=5.8 Hz, 2 H), 4.16 - 4.36 (m, 4 H), 5.53 - 5.61 (m, 1 H), 6.84 - 6.89 (m, 2 H), 7.39 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 424 [M+H]+	27

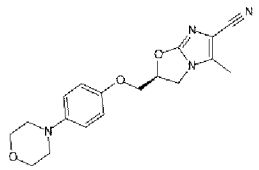
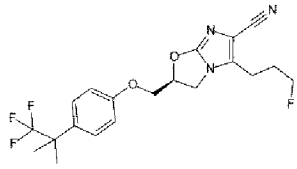
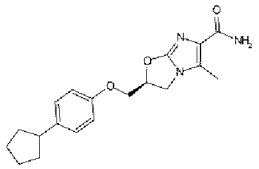
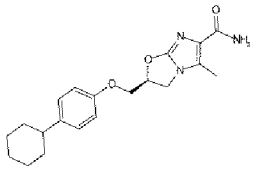
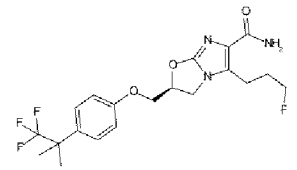
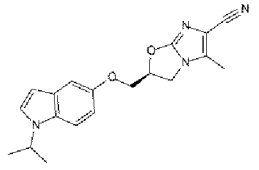
[0236]

[表2-47]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
278		(2S)-5-(3-メトキシプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 1.88 - 1.98 (m, 2 H), 2.96 - 3.08 (m, 2 H), 3.30 (s, 3 H), 3.40 (t, J=6.2 Hz, 2 H), 4.14 - 4.21 (m, 1 H), 4.23 - 4.33 (m, 3 H), 5.13 (br. s., 1 H), 5.50 - 5.58 (m, 1 H), 6.73 (br. s., 1 H), 6.85 - 6.91 (m, 2 H), 7.38 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 442 [M+H]+	40
279		(2S)-5-(トリフルオロメチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 4.27 - 4.50 (m, 4 H), 5.68 - 5.74 (m, 1 H), 6.83 - 6.90 (m, 2 H), 7.39 - 7.46 (m, 2 H); ESI MS m/z 420 [M+H]+	53
280		(2S)-2-[(4-シクロペンチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.47 - 1.84 (m, 6 H), 2.00 - 2.07 (m, 2 H), 2.34 (s, 3 H), 2.88 - 2.99 (m, 1 H), 4.15 - 4.31 (m, 4 H), 5.53 - 5.60 (m, 1 H), 6.78 - 6.84 (m, 2 H), 7.13 - 7.20 (m, 2 H); ESI MS m/z 324 [M+H]+	10
281		(2S)-2-[(4-シクロヘキシルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.17 - 1.29 (m, 1 H), 1.31 - 1.43 (m, 4 H), 1.69 - 1.89 (m, 5 H), 2.33 (s, 3 H), 2.41 - 2.49 (m, 1 H), 4.14 - 4.31 (m, 4 H), 5.53 - 5.59 (m, 1 H), 6.78 - 6.84 (m, 2 H), 7.11 - 7.16 (m, 2 H); ESI MS m/z 338 [M+H]+	10
282		(2S)-5-(3-ヒドロキシプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 1.87 - 1.95 (m, 2 H), 2.78 - 2.86 (m, 2 H), 3.71 (t, J=6.0 Hz, 2 H), 4.19 - 4.36 (m, 4 H), 5.55 - 5.61 (m, 1 H), 6.82 - 6.90 (m, 2 H), 7.39 - 7.46 (m, 2 H); ESI MS m/z 410 [M+H]+	54
283		(2S)-5-(トリフルオロメチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 4.26 - 4.53 (m, 4 H), 5.37 (br. s., 1 H), 5.60 - 5.69 (m, 1 H), 6.79 - 6.91 (m, 3 H), 7.39 - 7.47 (m, 2 H); ESI MS m/z 438 [M+H]+	40

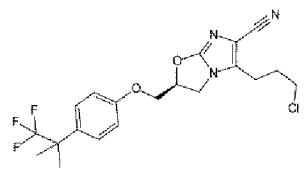
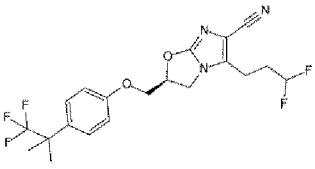
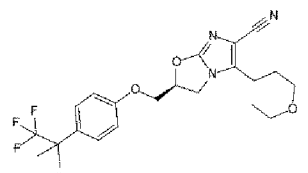
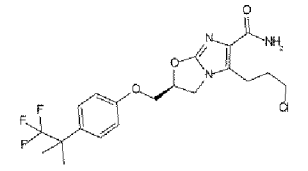
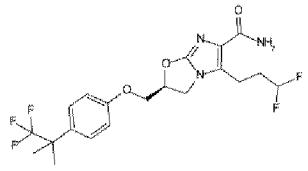
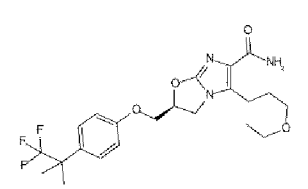
[0237]

[表2-48]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
284		(2S)-5-メチル-2-{[4-(モルホリン-4-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.34 (s, 3 H), 3.01 - 3.11 (m, 4 H), 3.79 - 3.91 (m, 4 H), 4.14 - 4.31 (m, 4 H), 5.50 - 5.61 (m, 1 H), 6.78 - 6.91 (m, 4 H); ESI MS m/z 341 [M+H]+	10
285		(2S)-5-(3-フルオロプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.53 - 1.58 (m, 6 H), 2.01 - 2.14 (m, 2 H), 2.82 - 2.89 (m, 2 H), 4.18 - 4.37 (m, 4 H), 4.44 - 4.57 (m, 2 H), 5.56 - 5.62 (m, 1 H), 6.84 - 6.89 (m, 2 H), 7.39 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 412 [M+H]+	3
286		(2S)-2-[(4-シクロペンチルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.47 - 1.85 (m, 6 H), 2.00 - 2.08 (m, 2 H), 2.52 (s, 3 H), 2.88 - 2.99 (m, 1 H), 4.10 - 4.33 (m, 4 H), 5.15 (br. s., 1 H), 5.49 - 5.58 (m, 1 H), 6.72 (br. s., 1 H), 6.79 - 6.85 (m, 2 H), 7.13 - 7.20 (m, 2 H); ESI MS m/z 342 [M+H]+	40
287		(2S)-2-[(4-シクロヘキシルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.17 - 1.43 (m, 5 H), 1.60 - 1.89 (m, 5 H), 2.40 - 2.48 (m, 1 H), 2.52 (s, 3 H), 4.11 - 4.15 (m, 1 H), 4.19 - 4.31 (m, 3 H), 5.16 (br. s., 1 H), 5.50 - 5.57 (m, 1 H), 6.72 (br. s., 1 H), 6.80 - 6.85 (m, 2 H), 7.11 - 7.16 (m, 2 H); ESI MS m/z 356 [M+H]+	40
288		(2S)-5-(3-フルオロプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 2.00 - 2.15 (m, 2 H), 3.00 - 3.12 (m, 2 H), 4.14 - 4.35 (m, 4 H), 4.43 (t, J=5.8 Hz, 1 H), 4.51 (t, J=5.8 Hz, 1 H), 5.18 (br. s., 1 H), 5.51 - 5.60 (m, 1 H), 6.75 (br. s., 1 H), 6.85 - 6.91 (m, 2 H), 7.38 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 430 [M+H]+	40
289		(2S)-5-メチル-2-({[1-(プロパン-2-イル)-1H-インドール-5-イル]オキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.49 - 1.54 (m, 6 H), 2.34 (s, 3 H), 4.19 - 4.37 (m, 4 H), 4.57 - 4.67 (m, 1 H), 5.54 - 5.63 (m, 1 H), 6.38 - 6.46 (m, 1 H), 6.79 - 6.85 (m, 1 H), 7.06 - 7.12 (m, 1 H), 7.20 - 7.30 (m, 2 H); ESI MS m/z 337 [M+H]+	55

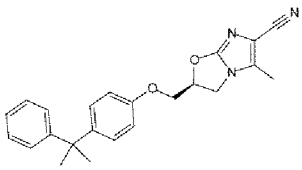
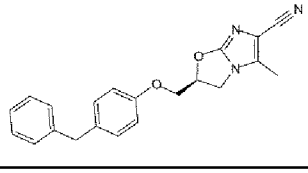
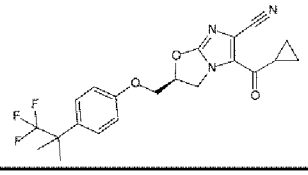
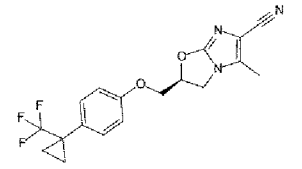
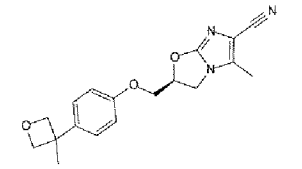
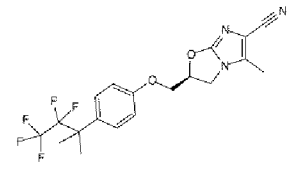
[0238]

[表2-49]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
290		(2S)-5-(3-クロロプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 2.12 - 2.20 (m, 2 H), 2.86 - 2.92 (m, 2 H), 3.57 - 3.63 (m, 2 H), 4.21 - 4.40 (m, 4 H), 5.55 - 5.63 (m, 1 H), 6.84 - 6.90 (m, 2 H), 7.39 - 7.46 (m, 2 H); ESI MS m/z 428 [M+H]+	56
291		(2S)-5-(3,3-ジフルオロプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 2.18 - 2.30 (m, 2 H), 2.85 - 2.93 (m, 2 H), 4.19 - 4.38 (m, 4 H), 5.56 - 5.63 (m, 1 H), 5.81 - 6.06 (m, 1 H), 6.84 - 6.90 (m, 2 H), 7.40 - 7.46 (m, 2 H); ESI MS m/z 430 [M+H]+	57
292		(2S)-5-(3-エトキシプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.17 (t, J=7.0 Hz, 3 H), 1.55 (s, 6 H), 1.87 - 1.94 (m, 2 H), 2.80 (t, J=7.4 Hz, 2 H), 3.43 - 3.48 (m, 4 H), 4.18 - 4.23 (m, 1 H), 4.26 - 4.34 (m, 3 H), 5.53 - 5.60 (m, 1 H), 6.84 - 6.89 (m, 2 H), 7.39 - 7.46 (m, 2 H); ESI MS m/z 438 [M+H]+	58
293		(2S)-5-(3-クロロプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 2.14 - 2.22 (m, 2 H), 3.05 - 3.13 (m, 2 H), 3.56 - 3.61 (m, 2 H), 4.20 - 4.37 (m, 4 H), 5.15 (br. s., 1 H), 5.52 - 5.60 (m, 1 H), 6.74 (br. s., 1 H), 6.85 - 6.92 (m, 2 H), 7.39 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 446 [M+H]+	40
294		(2S)-5-(3,3-ジフルオロプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 2.20 - 2.32 (m, 2 H), 3.03 - 3.13 (m, 2 H), 4.15 - 4.36 (m, 4 H), 5.19 (br. s., 1 H), 5.52 - 5.60 (m, 1 H), 5.75 - 6.01 (m, 1 H), 6.74 (br. s., 1 H), 6.85 - 6.91 (m, 2 H), 7.38 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 448 [M+H]+	40
295		(2S)-5-(3-エトキシプロピル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.16 (t, J=7.0 Hz, 3 H), 1.55 (s, 6 H), 1.88 - 1.96 (m, 2 H), 2.98 - 3.08 (m, 2 H), 3.39 - 3.46 (m, 4 H), 4.15 - 4.21 (m, 1 H), 4.25 - 4.33 (m, 3 H), 5.17 (br. s., 1 H), 5.50 - 5.57 (m, 1 H), 6.74 (br. s., 1 H), 6.84 - 6.90 (m, 2 H), 7.39 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 456 [M+H]+	40

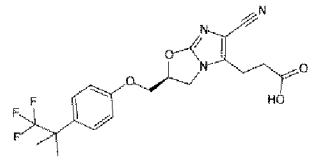
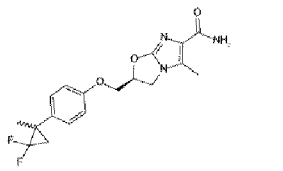
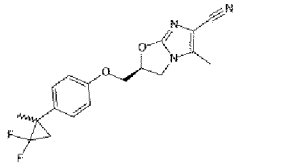
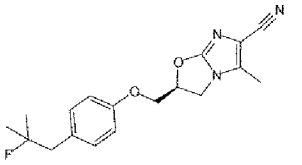
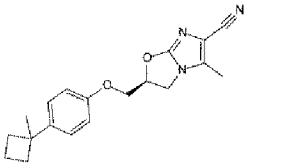
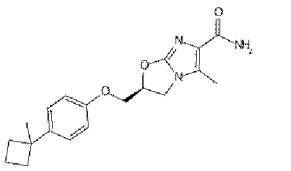
[0239]

[表2-50]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
296		(2S)-5-メチル-2-{[4-(2-フェニルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.66 (s, 6 H), 2.33 (s, 3 H), 4.14 - 4.31 (m, 4 H), 5.52 - 5.60 (m, 1 H), 6.75 - 6.82 (m, 2 H), 7.13 - 7.29 (m, 7 H); ESI MS m/z 374 [M+H]+	10
297		(2S)-2-[(4-ベンジルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.33 (s, 3 H), 3.93 (s, 2 H), 4.15 - 4.19 (m, 1 H), 4.21 - 4.30 (m, 3 H), 5.53 - 5.59 (m, 1 H), 6.78 - 6.82 (m, 2 H), 7.08 - 7.21 (m, 5 H), 7.24 - 7.30 (m, 2 H); ESI MS m/z 346 [M+H]+	10
298		(2S)-5-(シクロプロピルカルボニル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	101H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.18 (sxt, J=3.9 Hz, 2 H), 1.24 - 1.30 (m, 2 H), 1.52 - 1.58 (m, 6 H), 2.84 (tt, J=7.8, 4.5 Hz, 1 H), 4.26 - 4.39 (m, 2 H), 4.49 - 4.62 (m, 2 H), 5.64 - 5.70 (m, 1 H), 6.83 - 6.88 (m, 2 H), 7.42 (d, J=8.7 Hz, 2 H); ESI MS m/z 420 [M+H]+	59
299		(2S)-5-メチル-2-({4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.96 - 1.00 (m, 2 H), 1.31 - 1.35 (m, 2 H), 2.34 (s, 3 H), 4.15 - 4.20 (m, 1 H), 4.23 - 4.34 (m, 3 H), 5.55 - 5.61 (m, 1 H), 6.83 - 6.88 (m, 2 H), 7.37 - 7.42 (m, 2 H); ESI MS m/z 364 [M+H]+	10
300		(2S)-5-メチル-2-{[4-(3-メチルオキセタン-3-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.70 (s, 3 H), 2.35 (s, 3 H), 4.17 - 4.21 (m, 1 H), 4.24 - 4.34 (m, 3 H), 4.61 - 4.64 (m, 2 H), 4.90 - 4.93 (m, 2 H), 5.56 - 5.61 (m, 1 H), 6.86 - 6.90 (m, 2 H), 7.15 - 7.18 (m, 2 H); ESI MS m/z 326 [M+H]+	10
301		(2S)-5-メチル-2-{[4-(3,3,4,4,4-ペンタフルオロ-2-メチルブタン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.59 (s, 6 H), 2.35 (s, 3 H), 4.16 - 4.36 (m, 4 H), 5.55 - 5.63 (m, 1 H), 6.83 - 6.89 (m, 2 H), 7.38 - 7.44 (m, 2 H); ESI MS m/z 416 [M+H]+	10

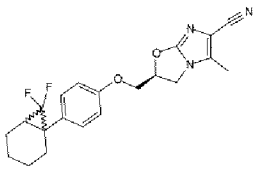
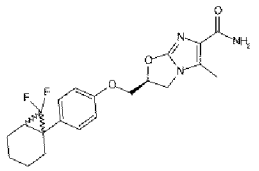
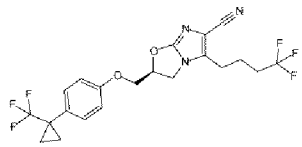
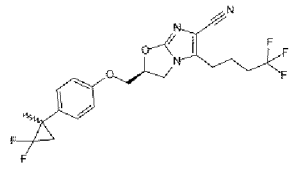
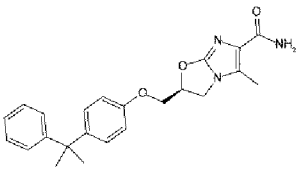
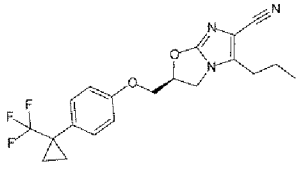
[0240]

[表2-51]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
302		3-[(2S)-6-シアノ-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-5-イル]プロパン酸	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 2.76 - 2.82 (m, 2 H), 2.94 - 3.00 (m, 2 H), 4.24 - 4.41 (m, 4 H), 5.54 - 5.62 (m, 1 H), 6.83 - 6.90 (m, 2 H), 7.39 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 424 [M+H]+	60
303		(2S)-2-{[4-(2,2-ジフルオロ-1-メチルシクロプロピル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.35 - 1.66 (m, 5 H), 2.52 (s, 3 H), 4.11 - 4.16 (m, 1 H), 4.21 - 4.31 (m, 3 H), 5.13 (br. s., 1 H), 5.51 - 5.58 (m, 1 H), 6.72 (br. s., 1 H), 6.83 - 6.90 (m, 2 H), 7.22 - 7.27 (m, 2 H); ESI MS m/z 364 [M+H]+	10
304		(2S)-2-{[4-(2,2-ジフルオロ-1-メチルシクロプロピル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.34 - 1.42 (m, 1 H), 1.48 (s, 3 H), 1.57 - 1.66 (m, 1 H), 2.33 (s, 3 H), 4.14 - 4.20 (m, 1 H), 4.23 - 4.33 (m, 3 H), 5.54 - 5.61 (m, 1 H), 6.82 - 6.89 (m, 2 H), 7.21 - 7.27 (m, 2 H); ESI MS m/z 346 [M+H]+	10
305		(2S)-2-{[4-(2-フルオロ-2-メチルプロピル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.27 - 1.34 (m, 6 H), 2.34 (s, 3 H), 2.80 - 2.88 (m, 2 H), 4.16 - 4.32 (m, 4 H), 5.55 - 5.61 (m, 1 H), 6.80 - 6.84 (m, 2 H), 7.11 - 7.17 (m, 2 H); ESI MS m/z 330 [M+H]+	10
306		(2S)-5-メチル-2-{[4-(1-メチルシクロブチル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.42 (s, 3 H), 1.77 - 1.85 (m, 1 H), 2.00 - 2.14 (m, 3 H), 2.29 - 2.36 (m, 5 H), 4.16 - 4.30 (m, 4 H), 5.53 - 5.60 (m, 1 H), 6.80 - 6.84 (m, 2 H), 7.07 - 7.12 (m, 2 H); ESI MS m/z 324 [M+H]+	10
307		(2S)-5-メチル-2-{[4-(1-メチルシクロブチル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.42 (s, 3 H), 1.77 - 1.85 (m, 1 H), 2.00 - 2.14 (m, 3 H), 2.30 - 2.37 (m, 2 H), 2.52 (s, 3 H), 4.14 (dd, J=9.9, 6.2 Hz, 1 H), 4.21 - 4.31 (m, 3 H), 5.14 (br. s., 1 H), 5.51 - 5.57 (m, 1 H), 6.74 (br. s., 1 H), 6.81 - 6.85 (m, 2 H), 7.08 - 7.12 (m, 2 H); ESI MS m/z 342 [M+H]+	40

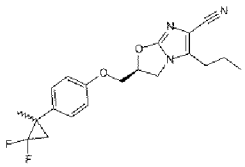
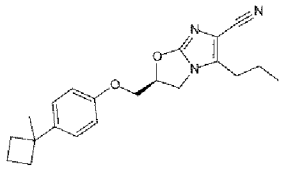
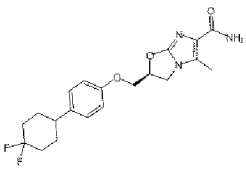
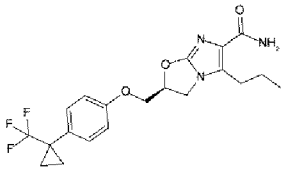
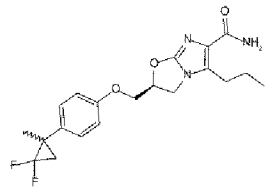
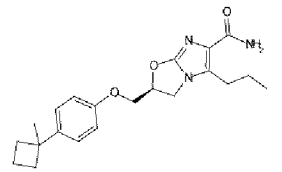
[0241]

[表2-52]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
308		(2S)-2-{[4-(7,7-ジフルオロビシクロ[4.1.0]ヘプタ-1-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.28 - 1.50 (m, 4 H), 1.68 - 1.84 (m, 3 H), 1.94 - 2.03 (m, 1 H), 2.10 - 2.17 (m, 1 H), 2.34 (s, 3 H), 4.14 - 4.20 (m, 1 H), 4.22 - 4.32 (m, 3 H), 5.53 - 5.61 (m, 1 H), 6.81 - 6.87 (m, 2 H), 7.19 - 7.24 (m, 2 H); ESI MS m/z 386 [M+H]+	10
309		(2S)-2-{[4-(7,7-ジフルオロビシクロ[4.1.0]ヘプタ-1-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.26 - 1.51 (m, 4 H), 1.68 - 1.84 (m, 3 H), 1.94 - 2.03 (m, 1 H), 2.10 - 2.18 (m, 1 H), 2.52 (s, 3 H), 4.09 - 4.17 (m, 1 H), 4.20 - 4.32 (m, 3 H), 5.17 (br. s., 1 H), 5.49 - 5.58 (m, 1 H), 6.73 (br. s., 1 H), 6.82 - 6.89 (m, 2 H), 7.18 - 7.23 (m, 2 H); ESI MS m/z 404 [M+H]+	10
310		(2S)-5-(4,4,4-トリフルオロブチル)-2-({4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.94 - 1.01 (m, 2 H), 1.29 - 1.36 (m, 2 H), 1.88 - 1.98 (m, 2 H), 2.14 - 2.25 (m, 2 H), 2.75 - 2.83 (m, 2 H), 4.16 - 4.38 (m, 4 H), 5.55 - 5.64 (m, 1 H), 6.80 - 6.87 (m, 2 H), 7.35 - 7.42 (m, 2 H); ESI MS m/z 460 [M+H]+	10
311		(2S)-2-{[4-(2,2-ジフルオロ-1-メチルシクロプロピル)フェノキシ]メチル}-5-(4,4,4-トリフルオロブチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.34 - 1.43 (m, 1 H), 1.48 (s, 3 H), 1.58 - 1.66 (m, 1 H), 1.87 - 1.98 (m, 2 H), 2.13 - 2.25 (m, 2 H), 2.75 - 2.83 (m, 2 H), 4.15 - 4.37 (m, 4 H), 5.56 - 5.63 (m, 1 H), 6.81 - 6.87 (m, 2 H), 7.21 - 7.28 (m, 2 H); ESI MS m/z 442 [M+H]+	10
312		(2S)-5-メチル-2-{[4-(2-フェニルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.66 (s, 6 H), 2.51 (s, 3 H), 4.10 - 4.16 (m, 1 H), 4.19 - 4.30 (m, 3 H), 5.17 (br. s., 1 H), 5.49 - 5.57 (m, 1 H), 6.72 (br. s., 1 H), 6.77 - 6.83 (m, 2 H), 7.12 - 7.30 (m, 7 H); ESI MS m/z 392 [M+H]+	40
313		(2S)-5-プロピル-2-({4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.95 - 1.03 (m, 5 H), 1.31 - 1.34 (m, 2 H), 1.68 (sxt, J=7.5 Hz, 2 H), 2.64 - 2.69 (m, 2 H), 4.18 (dd, J=9.9, 6.2 Hz, 1 H), 4.24 - 4.34 (m, 3 H), 5.54 - 5.60 (m, 1 H), 6.82 - 6.85 (m, 2 H), 7.39 (d, J=8.7 Hz, 2 H); ESI MS m/z 392 [M+H]+	10

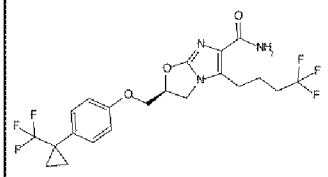
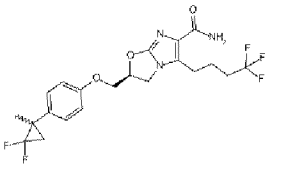
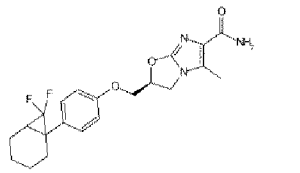
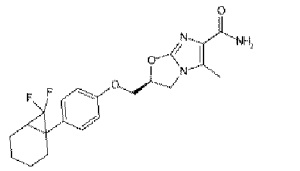
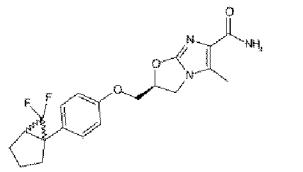
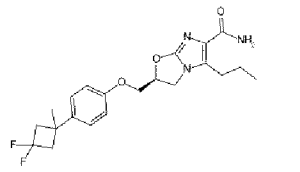
[0242]

[表2-53]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
314		(2S)-2-{[4-(2,2-ジフルオロ-1-メチルシクロプロピル)フェノキシ]メチル}-5-プロピル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.01 (t, J=7.4 Hz, 3 H), 1.38 (ddd, J=12.3, 7.5, 4.5 Hz, 1 H), 1.45 - 1.51 (m, 3 H), 1.59 - 1.72 (m, 3 H), 2.64 - 2.68 (m, 2 H), 4.14 - 4.20 (m, 1 H), 4.24 - 4.33 (m, 3 H), 5.53 - 5.59 (m, 1 H), 6.85 (d, J=7.8 Hz, 2 H), 7.23 - 7.26 (m, 2 H); ESI MS m/z 374 [M+H]+	10
315		(2S)-2-{[4-(1-メチルシクロブチル)フェノキシ]メチル}-5-プロピル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.01 (t, J=7.2 Hz, 3 H), 1.42 (s, 3 H), 1.68 (sxt, J=7.4 Hz, 2 H), 1.77 - 1.85 (m, 1 H), 2.00 - 2.14 (m, 3 H), 2.29 - 2.37 (m, 2 H), 2.64 - 2.69 (m, 2 H), 4.17 - 4.21 (m, 1 H), 4.24 - 4.32 (m, 3 H), 5.53 - 5.59 (m, 1 H), 6.79 - 6.83 (m, 2 H), 7.08 - 7.12 (m, 2 H); ESI MS m/z 352 [M+H]+	10
316		(2S)-2-{[4-(4,4-ジフルオロシクロヘキシル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.61 - 1.94 (m, 6 H), 2.14 - 2.25 (m, 2 H), 2.49 - 2.60 (m, 4 H), 4.10 - 4.17 (m, 1 H), 4.20 - 4.31 (m, 3 H), 5.19 (br. s., 1 H), 5.50 - 5.57 (m, 1 H), 6.73 (br. s., 1 H), 6.81 - 6.87 (m, 2 H), 7.11 - 7.18 (m, 2 H); ESI MS m/z 392 [M+H]+	10
317		(2S)-5-プロピル-2-({4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.94 - 1.00 (m, 5 H), 1.29 - 1.34 (m, 2 H), 1.61 - 1.70 (m, 2 H), 2.90 - 3.02 (m, 2 H), 4.12 - 4.18 (m, 1 H), 4.24 - 4.33 (m, 3 H), 5.12 (br. s., 1 H), 5.50 - 5.57 (m, 1 H), 6.74 (br. s., 1 H), 6.82 - 6.87 (m, 2 H), 7.39 (d, J=8.7 Hz, 2 H); ESI MS m/z 410 [M+H]+	40
318		(2S)-2-{[4-(2,2-ジフルオロ-1-メチルシクロプロピル)フェノキシ]メチル}-5-プロピル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.98 (t, J=7.4 Hz, 3 H), 1.35 - 1.40 (m, 1 H), 1.48 (s, 3 H), 1.56 - 1.69 (m, 3 H), 2.91 - 3.02 (m, 2 H), 4.13 - 4.17 (m, 1 H), 4.24 - 4.32 (m, 3 H), 5.12 (br. s., 1 H), 5.51 - 5.56 (m, 1 H), 6.75 (br. s., 1 H), 6.84 - 6.88 (m, 2 H), 7.23 - 7.26 (m, 2 H); ESI MS m/z 392 [M+H]+	40
319		(2S)-2-{[4-(1-メチルシクロブチル)フェノキシ]メチル}-5-プロピル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.98 (t, J=7.4 Hz, 3 H), 1.42 (s, 3 H), 1.61 - 1.70 (m, 2 H), 1.78 - 1.85 (m, 1 H), 2.00 - 2.15 (m, 3 H), 2.30 - 2.37 (m, 2 H), 2.90 - 3.02 (m, 2 H), 4.13 - 4.29 (m, 4 H), 5.13 (br. s., 1 H), 5.50 - 5.56 (m, 1 H), 6.76 (br. s., 1 H), 6.80 - 6.85 (m, 2 H), 7.07 - 7.12 (m, 2 H); ESI MS m/z 370 [M+H]+	40

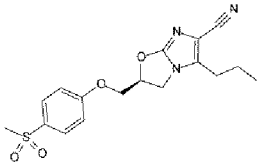
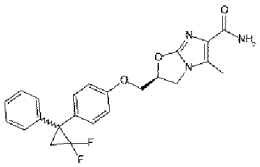
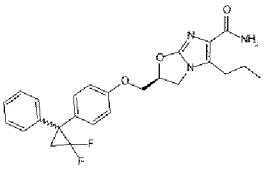
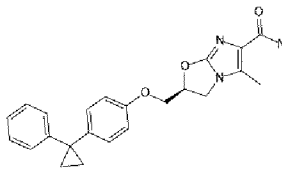
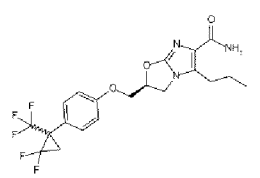
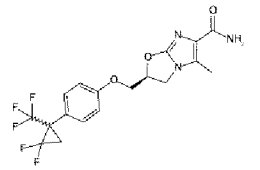
[0243]

[表2-54]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
320		(2S)-5-(4,4,4-トリフルオロブチル)-2-({4-[1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.92 - 1.01 (m, 2 H), 1.28 - 1.37 (m, 2 H), 1.84 - 1.93 (m, 2 H), 2.12 - 2.25 (m, 2 H), 3.03 - 3.13 (m, 2 H), 4.13 - 4.20 (m, 1 H), 4.23 - 4.37 (m, 3 H), 5.19 (br. s., 1 H), 5.53 - 5.60 (m, 1 H), 6.77 (br. s., 1 H), 6.82 - 6.88 (m, 2 H), 7.36 - 7.42 (m, 2 H); ESI MS m/z 478 [M+H]+	40
321		(2S)-2-{[4-(2,2-ジフルオロ-1-メチルシクロプロピル)フェノキシ]メチル}-5-(4,4,4-トリフルオロブチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.34 - 1.42 (m, 1 H), 1.48 (s, 3 H), 1.60 - 1.66 (m, 1 H), 1.84 - 1.94 (m, 2 H), 2.12 - 2.25 (m, 2 H), 3.02 - 3.13 (m, 2 H), 4.13 - 4.20 (m, 1 H), 4.23 - 4.36 (m, 3 H), 5.17 (br. s., 1 H), 5.51 - 5.62 (m, 1 H), 6.77 (br. s., 1 H), 6.82 - 6.90 (m, 2 H), 7.21 - 7.31 (m, 2 H); ESI MS m/z 460 [M+H]+	40
322		(2S)-2-{[4-(7,7-ジフルオロビシクロ[4.1.0]ヘプタ-1-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド		62
323		(2S)-2-{[4-(7,7-ジフルオロビシクロ[4.1.0]ヘプタ-1-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド		62
324		(2S)-2-{[4-(6,6-ジフルオロビシクロ[3.1.0]ヘキサ-1-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.67 - 1.92 (m, 2 H), 2.04 - 2.22 (m, 4 H), 2.37 - 2.48 (m, 1 H), 2.52 (s, 3 H), 4.09 - 4.17 (m, 1 H), 4.20 - 4.33 (m, 3 H), 5.15 (br. s., 1 H), 5.50 - 5.58 (m, 1 H), 6.72 (br. s., 1 H), 6.80 - 6.90 (m, 2 H), 7.15 - 7.21 (m, 2 H); ESI MS m/z 390 [M+H]+	10
325		(2S)-2-{[4-(3,3-ジフルオロ-1-メチルシクロブチル)フェノキシ]メチル}-5-プロピル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.98 (t, J=7.4 Hz, 3 H), 1.50 (s, 3 H), 1.66 (sxt, J=7.4 Hz, 2 H), 2.65 - 2.73 (m, 2 H), 2.84 - 3.02 (m, 4 H), 4.16 (dd, J=9.9, 6.2 Hz, 1 H), 4.24 - 4.33 (m, 3 H), 5.11 (br. s., 1 H), 5.51 - 5.57 (m, 1 H), 6.75 (br. s., 1 H), 6.86 (d, J=8.7 Hz, 2 H), 7.13 (d, J=8.7 Hz, 2 H); ESI MS m/z 428 [M+Na]+	10

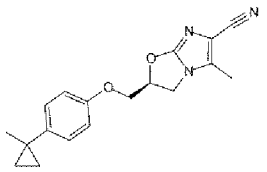
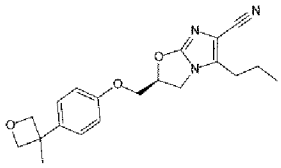
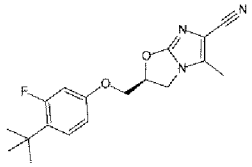
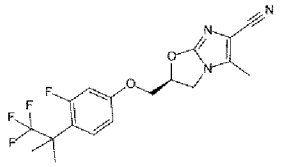
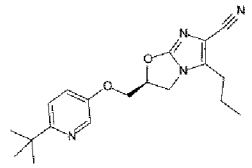
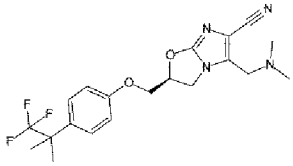
[0244]

[表2-55]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
326		(2S)-2-{[4-(メチルスルホニル)フェノキシ]メチル}-5-プロピル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.02 (t, J=7.4 Hz, 3 H), 1.69 (sxt, J=7.4 Hz, 2 H), 2.68 (t, J=7.5 Hz, 2 H), 3.04 (s, 3 H), 4.20 (dd, J=9.7, 6.4 Hz, 1 H), 4.29 - 4.38 (m, 2 H), 4.44 (dd, J=10.5, 4.3 Hz, 1 H), 5.59 - 5.65 (m, 1 H), 7.00 - 7.04 (m, 2 H), 7.88 - 7.92 (m, 2 H); ESI MS m/z 362 [M+H]+	10
327		(2S)-2-{[4-(2,2-ジフルオロ-1-フェニルシクロプロピル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.00 - 2.11 (m, 2 H), 2.51 (s, 3 H), 4.06 - 4.14 (m, 1 H), 4.18 - 4.29 (m, 3 H), 5.15 (br. s., 1 H), 5.46 - 5.56 (m, 1 H), 6.71 (br. s., 1 H), 6.80 - 6.88 (m, 2 H), 7.20 - 7.41 (m, 7 H); ESI MS m/z 426 [M+H]+	10
328		(2S)-2-{[4-(2,2-ジフルオロ-1-フェニルシクロプロピル)フェノキシ]メチル}-5-プロピル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.93 - 1.00 (m, 3 H), 1.60 - 1.68 (m, 2 H), 1.99 - 2.10 (m, 2 H), 2.89 - 3.01 (m, 2 H), 4.09 - 4.16 (m, 1 H), 4.20 - 4.30 (m, 3 H), 5.17 (br. s., 1 H), 5.47 - 5.55 (m, 1 H), 6.74 (br. s., 1 H), 6.80 - 6.86 (m, 2 H), 7.20 - 7.39 (m, 7 H); ESI MS m/z 454 [M+H]+	10
329		(2S)-5-メチル-2-{[4-(1-フェニルシクロプロピル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.21 - 1.29 (m, 4 H), 2.52 (s, 3 H), 4.10 - 4.16 (m, 1 H), 4.20 - 4.29 (m, 3 H), 5.13 (br. s., 1 H), 5.48 - 5.57 (m, 1 H), 6.72 (br. s., 1 H), 6.78 - 6.83 (m, 2 H), 7.14 - 7.31 (m, 7 H); ESI MS m/z 390 [M+H]+	10
330		(2S)-2-({4-[2,2-ジフルオロ-1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-5-プロピル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.95 - 1.00 (m, 3 H), 1.61 - 1.69 (m, 2 H), 1.84 - 1.93 (m, 1 H), 2.26 - 2.35 (m, 1 H), 2.90 - 3.02 (m, 2 H), 4.10 - 4.19 (m, 1 H), 4.23 - 4.36 (m, 3 H), 5.28 (br. s., 1 H), 5.51 - 5.58 (m, 1 H), 6.77 (br. s., 1 H), 6.91 (d, J=8.7 Hz, 2 H), 7.36 (d, J=8.7 Hz, 2 H); ESI MS m/z 446 [M+H]+	10
331		(2S)-2-({4-[2,2-ジフルオロ-1-(トリフルオロメチル)シクロプロピル]フェノキシ}メチル)-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.84 - 1.93 (m, 1 H), 2.26 - 2.34 (m, 1 H), 2.52 (s, 3 H), 4.08 - 4.17 (m, 1 H), 4.22 - 4.36 (m, 3 H), 5.20 (br. s., 1 H), 5.50 - 5.61 (m, 1 H), 6.73 (br. s., 1 H), 6.92 (d, J=8.7 Hz, 2 H), 7.36 (d, J=8.7 Hz, 2 H); ESI MS m/z 418 [M+H]+	10

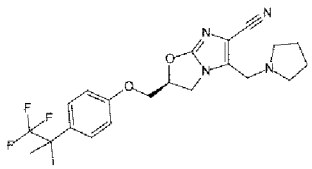
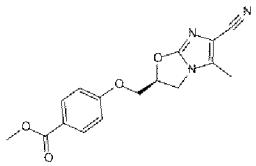
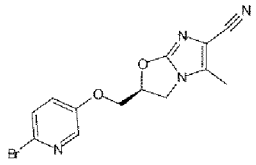
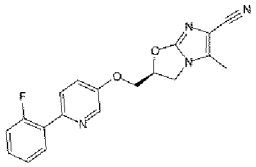
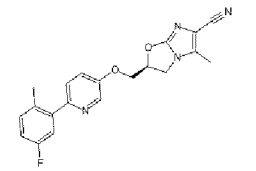
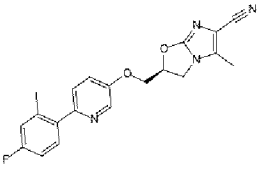
[0245]

[表2-56]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
332		(2S)-5-メチル-2-{[4-(1-メチルシクロプロピル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.67 - 0.71 (m, 2 H), 0.77 - 0.81 (m, 2 H), 1.36 (s, 3 H), 2.34 (s, 3 H), 4.15 - 4.29 (m, 4 H), 5.53 - 5.59 (m, 1 H), 6.77 - 6.82 (m, 2 H), 7.17 - 7.21 (m, 2 H); ESI MS m/z 310 [M+H]+	10
333		(2S)-2-{[4-(3-メチルオキセタン-3-イル)フェノキシ]メチル}-5-プロピル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 0.99 - 1.03 (m, 3 H), 1.65 - 1.72 (m, 5 H), 2.62 - 2.71 (m, 2 H), 4.17 - 4.21 (m, 1 H), 4.25 - 4.35 (m, 3 H), 4.61 - 4.64 (m, 2 H), 4.89 - 4.93 (m, 2 H), 5.54 - 5.60 (m, 1 H), 6.85 - 6.88 (m, 2 H), 7.14 - 7.19 (m, 2 H); ESI MS m/z 354 [M+H]+	10
334		(2S)-2-[(4-tert-ブチル-3-フルオロフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル		10
335		(2S)-2-{[3-フルオロ-4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル		10
336		(2S)-2-{[(6-tert-ブチルピリジン-3-イル)オキシ]メチル}-5-プロピル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.01 (t, J=7.2 Hz, 3 H), 1.34 (s, 9 H), 1.64 - 1.73 (m, 2 H), 2.63 - 2.72 (m, 2 H), 4.17 - 4.22 (m, 1 H), 4.24 - 4.39 (m, 3 H), 5.55 - 5.61 (m, 1 H), 7.13 (dd, J=9.1, 2.9 Hz, 1 H), 7.28 (d, J=9.1 Hz, 1 H), 8.24 (d, J=2.9 Hz, 1 H); ESI MS m/z 341 [M+H]+	10
337		(2S)-5-[(ジメチルアミノ)メチル]-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.57 (s, 6 H), 2.25 (s, 6 H), 3.45 - 3.52 (m, 2 H), 4.21 - 4.38 (m, 4 H), 5.52 - 5.60 (m, 1 H), 6.82 - 6.89 (m, 2 H), 7.38 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 409 [M+H]+	63

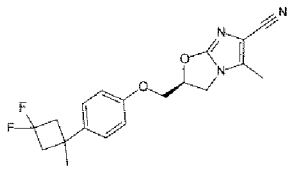
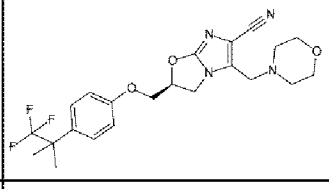
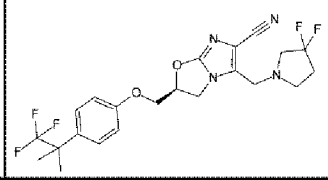
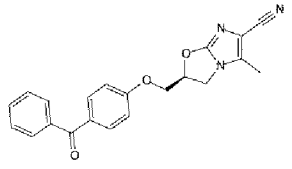
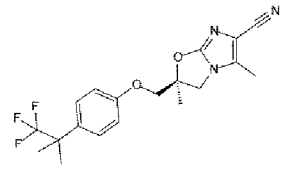
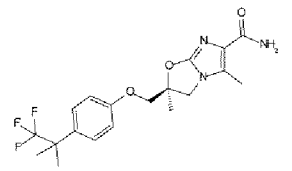
[0246]

[表2-57]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
338		(2S)-5-(ピロリジン-1-イルメチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.57 (s, 6 H), 1.78 (br. s., 4 H), 2.53 (br. s., 4 H), 3.68 (s, 2 H), 4.21 - 4.38 (m, 4 H), 5.53 - 5.60 (m, 1 H), 6.83 - 6.88 (m, 2 H), 7.38 - 7.46 (m, 2 H); ESI MS m/z 435 [M+H]+	63
339		メチル 4-({[(2S)-6-シアノ-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-2-イル]メトキシ}ベンゾアート	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 3.90 (s, 3 H), 4.16 - 4.22 (m, 1 H), 4.25 - 4.41 (m, 3 H), 5.57 - 5.64 (m, 1 H), 6.88 - 6.94 (m, 2 H), 7.99 - 8.04 (m, 2 H); ESI MS m/z 314 [M+H]+	10
340		(2S)-2-{[(6-ブロモピリジン-3-イル)オキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.35 (s, 3 H), 4.16 - 4.21 (m, 1 H), 4.26 - 4.41 (m, 3 H), 5.57 - 5.65 (m, 1 H), 7.13 (dd, J=8.7, 2.9 Hz, 1 H), 7.41 (d, J=8.7 Hz, 1 H), 8.07 (d, J=2.9 Hz, 1 H); ESI MS m/z 335 [M+H]+	10
341		(2S)-2-({[6-(2-フルオロフェニル)ピリジン-3-イル]オキシ}メチル)-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.37 (s, 3 H), 4.19 - 4.34 (m, 2 H), 4.37 - 4.47 (m, 2 H), 5.60 - 5.68 (m, 1 H), 7.11 - 7.19 (m, 1 H), 7.22 - 7.39 (m, 3 H), 7.75 - 7.80 (m, 1 H), 7.89 - 7.97 (m, 1 H), 8.42 (d, J=3.3 Hz, 1 H); ESI MS m/z 351 [M+H]+	13
342		(2S)-2-({[6-(5-フルオロ-2-メチルフェニル)ピリジン-3-イル]オキシ}メチル)-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.30 (s, 3 H), 2.37 (s, 3 H), 4.20 - 4.35 (m, 2 H), 4.38 - 4.48 (m, 2 H), 5.61 - 5.68 (m, 1 H), 6.96 - 7.01 (m, 1 H), 7.07 - 7.12 (m, 1 H), 7.19 - 7.24 (m, 1 H), 7.28 - 7.32 (m, 1 H), 7.34 - 7.38 (m, 1 H), 8.37 - 8.41 (m, 1 H); ESI MS m/z 365 [M+H]+	13
343		(2S)-2-({[6-(4-フルオロ-2-メチルフェニル)ピリジン-3-イル]オキシ}メチル)-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.33 (s, 3 H), 2.37 (s, 3 H), 4.21 - 4.34 (m, 2 H), 4.37 - 4.48 (m, 2 H), 5.60 - 5.67 (m, 1 H), 6.92 - 7.00 (m, 2 H), 7.27 - 7.35 (m, 3 H), 8.35 - 8.39 (m, 1 H); ESI MS m/z 365 [M+H]+	13

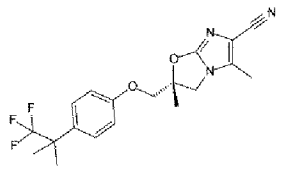
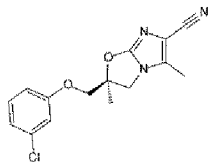
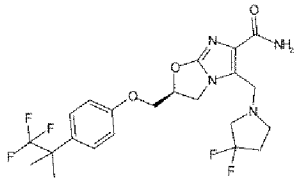
[0247]

[表2-58]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
344		(2S)-2-{[4-(3,3-ジフルオロ-1-メチルシクロブチル)フェノキシ]メチル}-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.50 (s, 3 H), 2.34 (s, 3 H), 2.64 - 2.74 (m, 2 H), 2.82 - 2.94 (m, 2 H), 4.15 - 4.34 (m, 4 H), 5.54 - 5.61 (m, 1 H), 6.83 - 6.89 (m, 2 H), 7.10 - 7.16 (m, 2 H); ESI MS m/z 360 [M+H]+	10
345		(2S)-5-(モルホリン-4-イルメチル)-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.56 (s, 6 H), 2.49 (t, J=4.3 Hz, 4 H), 3.58 (s, 2 H), 3.68 (t, J=4.3 Hz, 4 H), 4.25 - 4.38 (m, 4 H), 5.55 - 5.62 (m, 1 H), 6.82 - 6.88 (m, 2 H), 7.38 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 451 [M+H]+	63
346		(2S)-5-{(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)メチル}-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 2.23 - 2.35 (m, 2 H), 2.80 (t, J=7.2 Hz, 2 H), 2.92 (t, J=12.6 Hz, 2 H), 3.72 (s, 2 H), 4.23 - 4.40 (m, 4 H), 5.55 - 5.62 (m, 1 H), 6.83 - 6.88 (m, 2 H), 7.39 - 7.45 (m, 2 H); ESI MS m/z 471 [M+H]+	63
347		(2S)-2-[(4-ベンゾイルフェノキシ)メチル]-5-メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 2.36 (s, 3 H), 4.18 - 4.46 (m, 4 H), 5.60 - 5.67 (m, 1 H), 6.92 - 6.99 (m, 2 H), 7.44 - 7.51 (m, 2 H), 7.53 - 7.62 (m, 1 H), 7.71 - 7.86 (m, 4 H); ESI MS m/z 360 [M+H]+	10
348		(2S)-2,5-ジメチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 1.76 (s, 3 H), 2.32 (s, 3 H), 3.83 - 4.29 (m, 4 H), 6.83 - 6.86 (m, 2 H), 7.40 - 7.43 (m, 2 H); ESI MS m/z 380 [M+H]+	64
349		(2S)-2,5-ジメチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 1.75 (s, 3 H), 2.50 (s, 3 H), 3.82 - 4.27 (m, 4 H), 5.15 (br. s., 1 H), 6.73 (br. s., 1 H), 6.84 - 6.88 (m, 2 H), 7.39 - 7.44 (m, 2 H); ESI MS m/z 398 [M+H]+	40

[0248]

[表2-59]

化合物	構造式	名称	機器データ	実施例
350		(2R)-2,5-ジメチル-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.55 (s, 6 H), 1.76 (s, 3 H), 2.32 (s, 3 H), 3.83 - 4.30 (m, 4 H), 6.82 - 6.86 (m, 2 H), 7.40 - 7.44 (m, 2 H); ESI MS m/z 380 [M+H]+	1
351		(2S)-2-{(3-クロロフェノキシ)メチル}-2,5-ジメチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボニトリル	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.76 (s, 3 H), 2.32 - 2.34 (m, 3 H), 3.84 - 4.29 (m, 4 H), 6.73 - 6.77 (m, 1 H), 6.86 - 6.89 (m, 1 H), 6.98 - 7.02 (m, 1 H), 7.20 - 7.24 (m, 1 H); ESI MS m/z 304 [M+H]+	64
352		(2S)-5-{(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)メチル}-2-{[4-(1,1,1-トリフルオロ-2-メチルプロパン-2-イル)フェノキシ]メチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b][1,3]オキサゾール-6-カルボキサミド	1H NMR (600 MHz, CHLOROFORM-d) δ ppm 1.54 (s, 6 H), 2.19 - 2.33 (m, 2 H), 2.74 - 2.85 (m, 2 H), 2.89 - 3.00 (m, 2 H), 4.02 - 4.16 (m, 2 H), 4.20 - 4.29 (m, 2 H), 4.30 - 4.39 (m, 2 H), 5.17 (br. s., 1 H), 5.50 - 5.59 (m, 1 H), 6.79 (br. s., 1 H), 6.83 - 6.91 (m, 2 H), 7.36 - 7.44 (m, 2 H); ESI MS m/z 469 [M+H]+	40

[0249] 試験例１ [^{35}Ｓ]ＧＴＰγＳ結合試験（１）

（ラット型代謝型グルタミン酸受容体（ｍＧｌｕ２）安定発現ＣＨＯ細胞の粗膜画分調製）

ラット型ｍＧｌｕ２安定発現ＣＨＯ細胞を、１０％透析牛胎児血清含有ダルベッコ改変イーグル培地[１％ ｐｒｏｌｉｎｅ、５０ｕｎｉｔｓ／ｍＬ ｐｅｎｉｃｉｌｌｉｎ、５０μｇ／ｍＬ ｓｔｒｅｐｔｏｍｙｃｉｎ、１ｍＭ ｓｏｄｉｕｍ Ｐｙｒｕｖａｔｅ、１ｍＭ Ｓｕｃｃｉｎｉｃ ａｃｉｄ、２ｍＭ Ｌ－ｇｌｕｔａｍｉｎｅ（用時添加）]を用いて、３７℃、５％CO_2下で培養した。コンフルエント状態の細胞をＰＢＳ（－）で２回洗浄した後、セルスクレーパーで剥離し、４℃、１，０００ｒｐｍ、５分間遠心分離を行って細胞を回収した。得られた沈さを、２０ｍＭ ＨＥＰＥＳ緩衝液（ｐＨ７．４）に懸濁し、当該懸濁液をホモジナイザーでホモジナイズした後、４℃、４８，０００×ｇ、２０分間遠心分離することにより、再び沈さを得た。さらに得られた沈さを２回遠心洗浄した後に、上記緩衝液でホモジナイズすることにより粗膜画分を得た。得られた粗膜画分は、－８０℃で保存した。

[0250] ([^{35}S]ＧＴＰγＳ結合試験)

上記で調製した凍結膜画分を用時融解して、結合試験用緩衝液（終濃度；２０ｍＭ ＨＥＰＥＳ、１００ｍＭ ＮａＣｌ、１０ｍＭ $MgCl_2$、８．４μＭ ＧＤＰ、１０μｇ／ｍＬ ｓａｐｏｎｉｎ、０．１％ ＢＳＡ）にて希釈した。

実施例化合物を膜タンパク質１０μｇ／ａｓｓａｙの膜画分に添加して、３０℃で２０分間インキュベーションを行った。その後、グルタミン酸（終濃度３μＭ）と[^{35}S]ＧＴＰγＳ（終濃度０．１５ｎＭ）を添加して、３０℃で１時間インキュベーションを行った。インキュベーションの後、上記反応液をＧＦ／Ｃフィルター上に吸引濾過し、氷冷２０ｍＭ ＨＥＰＥＳ緩衝液（ｐＨ７．４）でＧＦ／Ｃフィルターを洗浄した。乾燥後、フィルターにシンチレーションカクテルを添加して、液体シンチレーションカウンターで膜結合放射活性を測定した。

[0251] 上記反応において、グルタミン酸非存在下で得られた[^{35}S]ＧＴＰγＳ結合量を非特異的結合量として、グルタミン酸存在下で得られた[^{35}S]ＧＴＰγＳ結合量との差を特異的結合量とした。３μＭグルタミン酸と様々な濃度における各実施例化合物共存下における特異的結合量との差から、各実施例化合物のEC_{50}値を非線形最小二乗法を用いた回帰曲線により算出した。

[0252] 各実施例化合物は、すべて、ラット型ｍＧｌｕ２受容体に作用して受容体反応を増強させた。本発明化合物のEC_{50}値を表３に例示する。

[0253]

[表3]

化合物	EC_{50}（nM）	化合物	EC_{50}（nM）	化合物	EC_{50}（nM）	化合物	EC_{50}（nM）	化合物	EC_{50}（nM）
1	8.7	78	280	161	24	230	34 (n=2)	290	2.6
2	149	80	206	162	14	231	29	291	10
3	32	82	10	163	21	232	20	292	9.6
4	127	83	154	164	27	233	2.2	293	164
6	39	84	92	165	146	234	234	294	101
7	278	86	27	166	61 (n=2)	235	70	295	60
8	49	87	< 10000	168	523	236	231	296	6.9
9	12	88	81	169	199	237	3.9 (n=3)	297	40
10	10	89	10	170	368	238	<10000	298	174
11	14	90	26	171	73	239	19	299	11
12	97	92	10	173	10	240	215	300	<10000
13	215	93	580	176	326	241	202	301	5.8
14	0.97	94	< 10000	177	199	242	38	302	<10000
15	< 10000	96	< 10000	178	67	243	11	303	581
16	181	97	< 10000	179	12	244	143	304	32
17	33	99	< 10000	180	21	246	116 (n=2)	305	251
18	1.7	101	189	181	397 (n=2)	247	434	306	12
19	285	102	87	182	842	248	108	307	137
20	330	103	< 10000	183	128	249	19	308	3.7
21	93	104	30	184	87	250	18	309	47
22	296	105	5	185	897	251	9.8	310	3.1
23	368	107	852	187	106	252	9.2	311	6.2
24	19	108	29	188	< 10000	253	47	312	65
25	342	109	432	189	347	254	88	313	3.1
27	< 10000	112	178	190	19	255	20	314	7.2
28	30	113	9.3	191	201	256	23	315	2.3
29	395	114	13	193	592	257	4.7	317	28
31	< 10000	115	48	195	575	258	62	318	89
32	758	117	109	196	< 10000	259	34	319	17
33	22	118	227	197	64	260	7.9 (n=2)	320	10
34	231	119	< 10000	198	711	261	38	321	27
35	168	120	280	199	199	262	31 (n=2)	322	88
36	81	121	78	200	226	263	97	323	34
40	786	122	21	201	<10000	264	<10000	324	121
41	< 10000	123	24	202	<10000	265	321	325	62
42	< 10000	124	741	203	29	266	1.3	327	274
44	70	125	28	204	<10000	267	14	328	81
46	18	126	11	205	137	268	7.2	329	72
47	428	128	100	206	115	269	1.5	330	53
48	358	129	35	207	687	270	9.3	331	175
50	< 10000	130	121	208	30	271	21	332	30
51	< 10000	131	118	209	13	272	41	333	81
53	< 10000	132	25	211	<10000	273	10	334	9.8
54	73	133	23	212	852	274	31	335	12
56	31	134	< 10000	213	213	275	135	336	56
57	< 10000	135	74	214	7.1	276	757	337	121
60	128	136	339	215	2.1	277	10	338	21
61	283	138	39	216	21	278	93	340	<10000
62	107	139	62	220	17	279	49	341	<10000
63	434	140	11	221	8.5	280	9.5	342	683
64	274	143	< 10000	222	<10000	281	4.1	343	633
66	24	148	13	223	8.8	282	263	344	47
67	307	149	9.8	224	59	283	<10000	345	3.3
68	2.5	152	602	225	56	285	15	346	0.9
70	82	156	104	226	1.5	286	204	347	194
71	28	158	115	227	1.0	287	67	348	152
74	< 10000	159	5.7	228	65	288	72	349	<10000
77	39	160	12	229	47	289	389	352	8.7

[0254] 試験例２ [^{35}Ｓ]ＧＴＰγＳ結合試験（２）

（ヒト型代謝型グルタミン酸受容体（ｍＧｌｕ２）安定発現ＣＨＯ細胞の粗膜画分調製）

ヒト型ｍＧｌｕ２安定発現ＣＨＯ細胞を、１０％透析牛胎児血清含有ダルベッコ改変イーグル培地［１％ ｐｒｏｌｉｎｅ、５０ｕｎｉｔｓ／ｍＬ ｐｅｎｉｃｉｌｌｉｎ、５０μｇ／ｍＬ ｓｔｒｅｐｔｏｍｙｃｉｎ、２ｍＭ Ｌ－ｇｌｕｔａｍｉｎｅ（用時添加）、４００μｇ／ｍＬ ＨｙｇｒｏｍｙｃｉｎＢ（用時添加）］を用いて、３７℃、５％CO_2下で培養した。コンフルエント状態の細胞をＰＢＳ（－）で２回洗浄した後、セルスクレーパーで剥離し、４℃、１，０００ｒｐｍ、５分間遠心分離を行って細胞を回収した。得られた沈さを、２０ｍＭ ＨＥＰＥＳ緩衝液（ｐＨ７．４）に懸濁し、当該懸濁液をホモジナイザーでホモジナイズした後、４℃、４８，０００×ｇ、２０分間遠心分離することにより、再び沈さを得た。さらに得られた沈さを２回遠心洗浄した後に、上記緩衝液でホモジナイズすることにより粗膜画分を得た。得られた粗膜画分は、－８０℃で保存した。

[0255] （[^{35}Ｓ]ＧＴＰγＳ結合試験）

上記で調製した凍結膜画分を用時融解して、結合試験用緩衝液（終濃度；２０ｍＭ ＨＥＰＥＳ、１００ｍＭ ＮａＣｌ、１０ｍＭ $MgCl_2$、８．４μＭ ＧＤＰ、１０μｇ／ｍＬ ｓａｐｏｎｉｎ、０．１％ ＢＳＡ）にて希釈した。実施例化合物を膜タンパク質１０μｇ／ａｓｓａｙの膜画分に添加して、３０℃で２０分間インキュベーションを行った。その後、グルタミン酸（終濃度１μＭ）と[^{35}Ｓ]ＧＴＰγＳ（終濃度０．１５ｎＭ）を添加して、３０℃で１時間インキュベーションを行った。インキュベーションの後、上記反応液をＧＦ／Ｃフィルター上に吸引濾過し、氷冷２０ｍＭ ＨＥＰＥＳ緩衝液（ｐＨ７．４）でＧＦ／Ｃフィルターを洗浄した。乾燥後、フィルターにシンチレーションカクテルを添加して、液体シンチレーションカウンターで膜結合放射活性を測定した。

上記反応において、グルタミン酸非存在下で得られた[^{35}Ｓ]ＧＴＰγＳ結合

量を非特異的結合量として、グルタミン酸存在下で得られた[^{35}Ｓ]ＧＴＰγＳ結合量との差を特異的結合量とした。１μＭグルタミン酸と様々な濃度における各実施例化合物共存下における特異的結合量との差から、各実施例化合物のＥＣ$_{50}$値を非線形最小二乗法を用いた回帰曲線により算出した。

[0256] 本発明化合物のＥＣ$_{50}$値を表４に例示する。

[0257] [表4]

化合物	EC$_{50}$（nM）	化合物	EC$_{50}$（nM）	化合物	EC$_{50}$（nM）
46	15	230	11 (n=2)	299	18
80	199	231	44	307	248
132	44	237	1.5 (n=3)	309	83
133	39	240	317	312	119
135	188	241	272	317	36
138	93	242	27	318	143
139	65	243	20	319	23
140	10	244	104	322	155
142	826	246	38 (n=2)	323	51
159	9.0	248	43	324	255
160	13	258	37	325	55
161	19	260	1.4 (n=2)	329	157
162	22	261	11	330	46
164	24	262	11 (n=2)	332	23
166	17 (n=2)	263	51	334	4.5
177	312	287	120	335	3.6
181	376	288	153	344	17
229	48	297	12	352	15

[0258] 試験例３　Ｍｅｔｈａｍｐｈｅｔａｍｉｎｅ誘発運動量亢進試験

（動物）

７週齢の雄性Ｗｉｓｔａｒ系ラット（日本チャールズリバー（株））を試験に使用した。温度（２３±３℃）、湿度（５０±２０％）、照明（７：００　ａｍ－７：００　ｐｍ）が制御された飼育室内で４日間以上予備飼育の後、試験に使用した。飼料（ＭＦ：　オリエンタル酵母工業（株））および飲料水（殺菌水）は自由に与えた。試験時に肉眼的な異常が見られない動物を使用した。

なお、本実験は大正製薬（株）総合研究所　動物実験倫理委員会の承認を得て行った。

（方法）

運動量測定装置はＳＣＡＮＥＴ（（有）メルクエスト）を用いた。測定ケージとして、透明なアクリル製箱（４５×２８×３０　ｃｍ）を使用した。試験前日に、動物を飼育室から移動し、実験室に馴化させた。試験日に、動物を個々に測定ケージに入れて６０分間の馴化を行った後、ｍｅｔｈａｍｐｈｅｔａｍｉｎｅ（１ｍｇ／ｋｇ）を皮下投与し、その後１２０分間の運動量測定を行った。データは１２０分間の運動量総量を用いて解析した。

化合物２３１、化合物２４３、化合物２９９　３０　ｍｇ／ｋｇはｍｅｔｈａｍｐｈｅｔａｍｉｎｅ投与６０分前、化合物２４０　３０　ｍｇ／ｋｇはｍｅｔｈａｍｐｈｅｔａｍｉｎｅ投与１２０分前の経口投与とした。比較対照群には０．５％メチルセルロース溶液を経口投与した。投与容量は２　ｍＬ／ｋｇとした。

（結果）

化合物２３１、化合物２４０、化合物２４３および化合物２９９の３０　ｍｇ／ｋｇはｍｅｔｈａｍｐｈｅｔａｍｉｎｅ誘発運動量亢進を有意に減弱した。

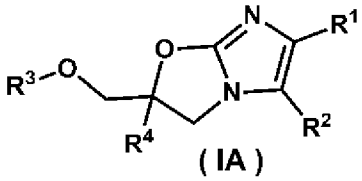
産業上の利用可能性

[0259]　本発明により、統合失調症、アルツハイマー病、認知機能障害、認知症、不安障害、うつ病、ＡＤ／ＨＤ（注意欠如/多動性障害）、薬物依存、痙攣、振戦及び睡眠障害等の治療又は予防剤を提供することが可能となる。

請求の範囲

［請求項1］ 式（ＩＡ）

［化1］



（ＩＡ）

［式（ＩＡ）中、

R^1は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、ヒドロキシ、及びC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、アミノ（該アミノはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル、及びC_{1-6}アルカノイルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、アリール、ヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、又はカルボキシを示し；

R^2は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１～３個のハロゲン原子で置換されてもよい。）、イミノ、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、アリール、C_{3-8}シクロアルキル、及びカルボキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキル

で置換されてもよい。）、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、C_{1-6}アルキルスルホニル、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又は４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、トリC_{1-6}アルキルシリル、アリールカルボニル、アリールスルホニル、C_{3-8}シクロアルキル、C_{2-6}アルケニル（該C_{2-6}アルケニルはC_{1-6}アルコキシで置換されてもよい。）、又はC_{3-8}シクロアルキルカルボニルを示し；

R^3は、アリール、ヘテロアリール、又はC_{3-8}シクロアルキル（該アリール、ヘテロアリール、及びC_{3-8}シクロアルキルは、ハロゲン原子、C_{1-8}アルキル（該C_{1-8}アルキルはシアノ、ヒドロキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びアリールからなる群より選ばれる１～５個の基で置換されてもよい。）、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、アリールオキシ、C_{1-6}アルカノイル、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ及びC_{1-6}アルカノイルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで

置換されてもよい。）、４～８員の環状エーテル（該４～８員の環状エーテルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、C_{5-8}ビシクロアルキル（該C_{5-8}ビシクロアルキルは１～３個のハロゲン原子で置換されてもよい。）、アダマンチル、C_{1-6}アルコキシカルボニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、及びアリールカルボニルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、キノリノニル（該キノリノニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はインダニル（該インダニルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）を示し；

R^4は、水素原子又はC_{1-6}アルキルを示す］

で表されるジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

［請求項2］ 上記式（ＩＡ）において、

R^4が、水素原子である請求項１に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

［請求項3］ 上記式（ＩＡ）において、

R^1が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、ヒドロキシ、及びC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリール（該ヘテロアリールはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）であり；

R^2が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、イミノ、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、アリール、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、

C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、C_{1-6}アルキルスルホニル、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又は４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、トリC_{1-6}アルキルシリル、C_{3-8}シクロアルキル又はC_{3-8}シクロアルキルカルボニルであり；

R^3が、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールは、ハロゲン原子、C_{1-8}アルキル（該C_{1-8}アルキルはシアノ、ヒドロキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びアリールからなる群より選ばれる１～５個の基で置換されてもよい。）、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、アリールオキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状エーテル（該４～８員の環状エーテルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、C_{5-8}ビシクロアルキル（該C_{5-8}ビシクロアルキルは１～３個のハロゲン原子で置換されてもよい。）、アダマンチル、及びアリールカルボニルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、又はインダ

ニル（該インダニルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）である請求項１又は２に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

［請求項4］ 上記式（ＩＡ）において、

R^1が、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリールである請求項１～３いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

［請求項5］ 上記式（ＩＡ）において、

R^1が、シアノ、又はカルバモイルである請求項１～４いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

［請求項6］ 上記式（ＩＡ）において、

R^2が、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、C_{1-6}アルコキシ、アリール、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは１～３個のC_{1-6}アルコキシ基で置換されてもよい。）、又はC_{3-8}シクロアルキルである請求項１～５いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

［請求項7］ 上記式（ＩＡ）において、

R^2が、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、又はC_{3-8}シクロアルキルである請求項１～６いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

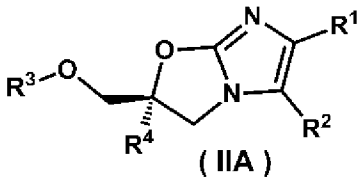
［請求項8］ 上記式（ＩＡ）において、

R^3が、アリール（該アリールは、ハロゲン原子、C_{1-8}アルキル（該C_{1-8}アルキルは１～３個のアリールで置換されてもよい。）、ハロC

$_{1-6}$アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びアリールからなる群より選ばれる１～５個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状エーテル（該４～８員の環状エーテルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、C_{5-8}ビシクロアルキル（該C_{5-8}ビシクロアルキルは１～３個のハロゲン原子で置換されてもよい。）、アダマンチル、及びアリールカルボニルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは、ハロゲン原子、アルキル、及びアリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、又はインダニル（該インダニルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）である請求項１～７いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

[請求項9] 上記式（ＩＡ）が、下記式（ＩＩＡ）

[化2]

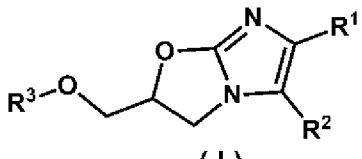


(IIA)

である請求項１～８いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

[請求項10] 式（Ｉ）

[化3]



(I)

［式（Ｉ）中、

R^1は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、ヒドロキシ、及びC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、アミノ（該アミノはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル、及びC_{1-6}アルカノイルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）を示し；

R^2は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、イミノ、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、C_{1-6}アルキルスルホニル、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又は４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキル

で置換されてもよい。）、又はトリC_{1-6}アルキルシリルを示し；

R^3は、アリール、ヘテロアリール、又はC_{3-8}シクロアルキル（該アリール、ヘテロアリール、及びC_{3-8}シクロアルキルは、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、アリールオキシ、C_{1-6}アルカノイル、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ及びC_{1-6}アルカノイルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、及びピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、又はキノリノニル（該キノリノニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）

を示す］

で表されるジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

［請求項11］　上記式（Ｉ）において、

R^1が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、ヒドロキシ、及びC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリール（該ヘテロアリールはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}

アルキル、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）であり；

R^2が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、イミノ、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、C_{1-6}アルキルスルホニル、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又は４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はトリC_{1-6}アルキルシリルであり；

R^3が、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールは、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、アリールオキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、及びピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）である請求項１０に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール

誘導体、又はその医薬上許容される塩。

[請求項12] 上記式（Ｉ）において、

R^1が、ハロゲン原子、シアノ、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリールである請求項１０又は１１に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

[請求項13] 上記式（Ｉ）において、

R^1が、シアノ、又はカルバモイルである請求項１０～１２いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

[請求項14] 上記式（Ｉ）において、

R^2が、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、C_{1-6}アルコキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、又はヘテロアリール（該ヘテロアリールは、１～３個のC_{1-6}アルコキシで置換されてもよい。）である請求項１０～１３いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

[請求項15] 上記式（Ｉ）において、

R^2が、C_{1-6}アルキル、又はハロC_{1-6}アルキルである請求項１０～１４いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

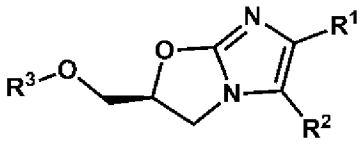
[請求項16] 上記式（Ｉ）において、

R^3が、アリール（該アリールは、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロ

C_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、及びヘテロアリール（該ヘテロアリールは、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）である請求項１０～１５いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

［請求項17］ 上記式（Ｉ）が、下記式（ＩＩ）

［化4］



(II)

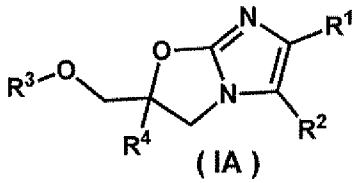
である請求項１０～１６いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

［請求項18］ 請求項１～１７のいずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩を有効成分として含有する医薬組成物。

［請求項19］ 請求項１～１７のいずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩を有効成分として含有することを特徴とする、統合失調症、アルツハイマー病、認知機能障害、認知症、不安障害、うつ病、ＡＤ／ＨＤ（注意欠如/多動性障害）、薬物依存、痙攣、振戦及び睡眠障害からなる群から選択される疾患の予防又は治療用医薬。

補正された請求の範囲
[2013年1月10日(10.01.2013) 国際事務局受理]

【請求項１】
式（ＩＡ）
【化１】



(IA)

［式（ＩＡ）中、
R^1は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、ヒドロキシ、及びC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、アミノ（該アミノはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル、及びC_{1-6}アルカノイルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、アリール、ヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、又はカルボキシを示し；
R^2は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１～３個のハロゲン原子で置換されてもよい。）、イミノ、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、アリール、C_{3-8}シクロアルキル、及びカルボキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、C_{1-6}アルキルスルホニル、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又は４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、トリC_{1-6}アルキルシリル、アリールカルボニル、アリールスルホニル、C_{3-8}シクロアルキル、C_{2-6}アルケニル（該C_{2-6}アルケニルはC_{1-6}アルコキシで置換されてもよい。）、又はC_{3-8}シクロアルキルカルボニルを示し；
R^3は、アリール、ヘテロアリール、又はC_{3-8}シクロアルキル（該アリール、ヘテロアリール、及びC_{3-8}シクロアルキルは、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルはシアノ、ヒドロキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びアリールからなる群より選ばれる１～５個の基で置換されてもよい。）、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ

、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、アリールオキシ、C_{1-6}アルカノイル、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ及びC_{1-6}アルカノイルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状エーテル（該４～８員の環状エーテルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、C_{5-8}ビシクロアルキル（該C_{5-8}ビシクロアルキルは１～３個のハロゲン原子で置換されてもよい。）、アダマンチル、C_{1-6}アルコキシカルボニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、及びアリールカルボニルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、キノリノニル（該キノリノニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はインダニル（該インダニルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）を示し；
R^4は、水素原子又はC_{1-6}アルキルを示す]
で表されるジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。
【請求項２】
上記式（ＩＡ）において、
R^4が、水素原子である請求項１に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。
【請求項３】
上記式（ＩＡ）において、
R^1が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、ヒドロキシ、及びC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリール（該ヘテロアリールはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）であり；
R^2が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、イミノ、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、アリール、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、C_{1-6}アルキルスルホニル、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又は４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、トリC_{1-6}アルキルシリル、C_{3-8}シクロアルキル又はC_{3-8}シクロアルキルカルボニルであり；
R^3が、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールは、ハロゲン原子、C_{1-8}アルキル（該C_{1-8}アルキルはシアノ、ヒドロキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-}

$_{8}$シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びアリールからなる群より選ばれる１～５個の基で置換されてもよい。）、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、アリールオキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状エーテル（該４～８員の環状エーテルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、C_{5-8}ビシクロアルキル（該C_{5-8}ビシクロアルキルは１～３個のハロゲン原子で置換されてもよい。）、アダマンチル、及びアリールカルボニルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、又はインダニル（該インダニルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）である請求項１又は２に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

【請求項４】

上記式（ＩＡ）において、

R^1が、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリールである請求項１～３いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

【請求項５】

上記式（ＩＡ）において、

R^1が、シアノ、又はカルバモイルである請求項１～４いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

【請求項６】

上記式（ＩＡ）において、

R^2が、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、C_{1-6}アルコキシ、アリール、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは１～３個のC_{1-6}アルコキシ基で置換されてもよい。）、又はC_{3-8}シクロアルキルである請求項１～５いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

【請求項７】

上記式（ＩＡ）において、

R^2が、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、又はC_{3-8}シクロアルキルである請求項１～６いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

【請求項８】（補正後）

上記式（ＩＡ）において、

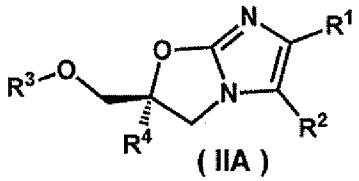
R^3が、アリール（該アリールは、ハロゲン原子、C_{1-8}アルキル（該C_{1-8}アルキルは１～３個のアリールで置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びアリールからなる群より選ばれる１～５個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1}

$_{-6}$アルコキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状エーテル（該４～８員の環状エーテルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、C_{5-8}ビシクロアルキル（該C_{5-8}ビシクロアルキルは１～３個のハロゲン原子で置換されてもよい。）、アダマンチル、及びアリールカルボニルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは、ハロゲン原子、C_{1-8}アルキル、及びアリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、又はインダニル（該インダニルは１～３個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）である請求項１～７いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

【請求項９】

上記式（ＩＡ）が、下記式（ＩＩＡ）

【化２】



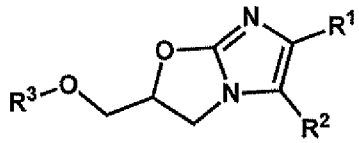
(IIA)

である請求項１～８いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

【請求項１０】

式（Ｉ）

【化３】



(I)

[式（Ｉ）中、

R^1は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、ヒドロキシ、及びC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、アミノ（該アミノはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル、及びC_{1-6}アルカノイルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）を示し；

R^2は、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、イミノ、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、及びアリールからなる群より選ばれ

る１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、C_{1-6}アルキルスルホニル、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又は４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はトリC_{1-6}アルキルシリルを示し；

R^3は、アリール、ヘテロアリール、又はC_{3-8}シクロアルキル（該アリール、ヘテロアリール、及びC_{3-8}シクロアルキルは、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、アリールオキシ、C_{1-6}アルカノイル、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ及びC_{1-6}アルカノイルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、及びピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、又はキノリノニル（該キノリノニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）

を示す]

で表されるジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

【請求項１１】

上記式（Ｉ）において、

R^1が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、ヒドロキシ、及びC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリール（該ヘテロアリールはC_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びC_{3-8}シクロアルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）であり；

R^2が、水素原子、ハロゲン原子、シアノ、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、イミノ、ヒドロキシ、C_{1-6}アルコキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{2-6}アルケニル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルコキシ、C_{3-8}シクロアルキルオキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、C_{1-6}アルキルスルホニル、アミノ（該アミノは１又は２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又は４～８員の環状アミノ（該４～８員の環状アミノは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）

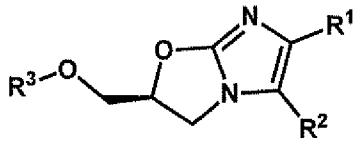
からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はトリC_{1-6}アルキルシリルであり；
R^3が、アリール、又はヘテロアリール（該アリール、及びヘテロアリールは、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、C_{1-6}アルコキシ、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリールC_{1-6}アルコキシ、アリールオキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ヘテロアリール（該ヘテロアリールは、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、４～８員の環状アミノ、及びピリドニル（該ピリドニルは１個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）である請求項１０に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。
【請求項１２】
上記式（Ｉ）において、
R^1が、ハロゲン原子、シアノ、ハロC_{1-6}アルキル、C_{1-6}アルカノイル、C_{1-6}アルキルスルホニル、カルバモイル（該カルバモイルは２個のC_{1-6}アルキルで置換されてもよい。）、又はヘテロアリールである請求項１０又は１１に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。
【請求項１３】
上記式（Ｉ）において、
R^1が、シアノ、又はカルバモイルである請求項１０～１２いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。
【請求項１４】
上記式（Ｉ）において、
R^2が、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル（該C_{1-6}アルキルは、C_{1-6}アルコキシ、及びアリールからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルキル、又はヘテロアリール（該ヘテロアリールは、１～３個のC_{1-6}アルコキシで置換されてもよい。）である請求項１０～１３いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。
【請求項１５】
上記式（Ｉ）において、
R^2が、C_{1-6}アルキル、又はハロC_{1-6}アルキルである請求項１０～１４いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。
【請求項１６】
上記式（Ｉ）において、
R^3が、アリール（該アリールは、ハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、C_{3-8}シクロアルキル（該C_{3-8}シクロアルキルはC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１又は２個の基で置換されてもよい。）、ハロC_{1-6}アルコキシ、アリール（該アリールはハロゲン原子、C_{1-6}アルキル、ハロC_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルコキシからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。

）、及びヘテロアリール（該ヘテロアリールは、C_{1-6}アルキル、及びハロC_{1-6}アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）である請求項１０～１５いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

【請求項１７】

上記式（Ｉ）が、下記式（ＩＩ）

【化４】



(II)

である請求項１０～１６いずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩。

【請求項１８】

請求項１～１７のいずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩を有効成分として含有する医薬組成物。

【請求項１９】

請求項１～１７のいずれか１項に記載のジヒドロイミダゾオキサゾール誘導体、又はその医薬上許容される塩を有効成分として含有することを特徴とする、統合失調症、アルツハイマー病、認知機能障害、認知症、不安障害、うつ病、ＡＤ／ＨＤ（注意欠如/多動性障害）、薬物依存、痙攣、振戦及び睡眠障害からなる群から選択される疾患の予防又は治療用医薬。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2012/077697

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
See extra sheet.

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D498/04, A61K31/424, A61K31/427, A61K31/4439, A61K31/444, A61K31/497, A61K31/501, A61K31/506, A61K31/5377, A61K31/695, A61P25/08, A61P25/18, A61P25/20, A61P25/22, A61P25/24, A61P25/28, A61P25/30, C07F7/10

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
CAplus(STN), REGISTRY(STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2010-520880 A (Sanofi-Aventis), 17 June 2010 (17.06.2010), entire text; particularly, claim 1; examples 1, 147 & WO 2008/112483 A2 & WO 2008/112483 A3 & AU 2008226649 A1 & CA 2680262 A1 & KR 2009121381 A & EP 2137193 A2 & NZ 579431 A & SG 179453 A1 & IL 200695 A & AR 65651 A1 & ZA 2009005564 A & MX 2009009447 A & US 2010/0075994 A1 & CN 101675060 A	1-19
A	WO 2011/034832 A1 (SANOFI-AVENTIS), 24 March 2011 (24.03.2011), entire text; particularly, claim 1; examples 1, 64 & AR 78172 A1	1-19

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
13 November, 2012 (13.11.12)	27 November, 2012 (27.11.12)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office Facsimile No.	Authorized officer Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2012/077697

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2011/034830 A1 (SANOFI-AVENTIS), 24 March 2011 (24.03.2011), entire text; particularly, claim 1; examples 1, 14 & AR 78171 A1 & CA 2773555 A1 & AU 2010295802 A1 & CN 102498116 A & KR 2012068005 A & EP 2477994 A1 & US 2012/0184566 A1	1-19
A	WO 2011/034828 A1 (SANOFI-AVENTIS), 24 March 2011 (24.03.2011), entire text; particularly, claim 1; examples 1, 125 & AR 78173 A1	1-19
A	JP 2011-520890 A (Merck Sharp & Dohme Corp.), 21 July 2011 (21.07.2011), entire text; particularly, claim 1; scheme 1; table 1 & WO 2009/140163 A1 & AU 2009246626 A1 & CA 2723727 A1 & EP 2291078 A1 & US 2011/0124661 A1	1-19
A	JP 2002-105085 A (Yamanouchi Pharmaceutical Co., Ltd.), 10 April 2002 (10.04.2002), entire text; particularly, claim 1; example 1; paragraphs [0049] to [0051] (Family: none)	1-19
A	F.M. SABBATINI et al, Metabotropic glutamate receptors: potential therapeutic applications of recently disclosed new chemical entities, EXPERT OPIN. THER. PATENTS, 2004, Vol.14, No. 11, p.1593-1604, entire text, particularly, fig. 8, 9	1-19
A	JP 58-013587 A (Otsuka Pharmaceutical Factory, Inc.), 26 January 1983 (26.01.1983), entire text; particularly, claim 1; example 1 & JP 61-046476 B2	1-19

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2012/077697

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 2004-149527 A (Otsuka Pharmaceutical Co., Ltd.), 27 May 2004 (27.05.2004), entire text; particularly, claim 1; example 776 & WO 2004/033463 A1 & CA 2497569 A1 & CA 2497569 C & AU 2003272979 A1 & AU 2003272979 B2 & BR 2003014344 A & EP 1555267 A1 & CN 1705670 A & CN 100366624 C & CN 101172981 A & RU 2326121 C2 & CN 101255170 A & CN 102532162 A & JP 4186065 B2 & ZA 2005001033 A	1-19
A	WO 2011/014776 A1 (GLOBAL ALLIANCE FOR TB DRUG DEVELOPMENT), 03 February 2011 (03.02.2011), entire text; particularly, claim 1; fig. 18 & CA 2769263 A1 & US 2011/0028466 A1 & US 8293734 B2 & AU 2010278779 A1 & EP 2459570 A1 & KR 2012084714 A & CN 102741259 A	1-19

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/JP2012/077697

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
(International Patent Classification (IPC))

C07D498/04(2006.01)i, *A61K31/424*(2006.01)i, *A61K31/427*(2006.01)i, *A61K31/4439*(2006.01)i, *A61K31/444*(2006.01)i, *A61K31/497*(2006.01)i, *A61K31/501*(2006.01)i, *A61K31/506*(2006.01)i, *A61K31/5377*(2006.01)i, *A61K31/695*(2006.01)i, *A61P25/08*(2006.01)i, *A61P25/18*(2006.01)i, *A61P25/20*(2006.01)i, *A61P25/22*(2006.01)i, *A61P25/24*(2006.01)i, *A61P25/28*(2006.01)i, *A61P25/30*(2006.01)i, *C07F7/10*(2006.01)i

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC)

Subject to be covered by this search:

The phrase "the heteroaryl group is a halogen atom, an alkyl group and an aryl group" in the definition of R^3 in claim 8, which is "a heteroaryl group (the heteroaryl group is a halogen atom, an alkyl group and an aryl group (the aryl group may be substituted by one to three groups selected from the group consisting of halogen atoms, C1-6 alkyl groups and halo C1-6 alkyl groups)", does not make sense in Japanese.

By taking the definition of claim 1 on which claim 8 is dependent and the like into consideration, the international search has been carried out on the understanding that the above-mentioned phrase "a heteroaryl group (the heteroaryl group is a halogen atom, an alkyl group and an aryl group (the aryl group may be substituted by one to three groups selected from the group consisting of halogen atoms, C1-6 alkyl groups and halo C1-6 alkyl groups)", which is the definition of R^3 in claim 8, is a clerical error for "a heteroaryl group (the heteroaryl group may be substituted by one to three groups selected from the group consisting of halogen atoms, alkyl groups and aryl groups (the aryl groups may be substituted by one to three groups selected from the group consisting of halogen atoms, C1-6 alkyl groups and halo C1-6 alkyl groups))".

国際調査報告

国際出願番号　ＰＣＴ／ＪＰ２０１２／０７７６９７

Ａ．　発明の属する分野の分類（国際特許分類（ＩＰＣ））

Int.Cl.　特別ページ参照

Ｂ．　調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（ＩＰＣ））

Int.Cl.　C07D498/04, A61K31/424, A61K31/427, A61K31/4439, A61K31/444, A61K31/497, A61K31/501, A61K31/506, A61K31/5377, A61K31/695, A61P25/08, A61P25/18, A61P25/20, A61P25/22, A61P25/24, A61P25/28, A61P25/30, C07F7/10

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース（データベースの名称、調査に使用した用語）

CAplus(STN), REGISTRY(STN)

Ｃ．　関連すると認められる文献

引用文献のカテゴリー＊	引用文献名　及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する請求項の番号
A	JP 2010-520880 A（サノフィーアベンティス）2010.06.17, 文献全体、特に、請求項１、実施例１及び１４７等参照 & WO 2008/112483 A2 & WO 2008/112483 A3 & AU 2008226649 A1 & CA 2680262 A1 & KR 2009121381 A & EP 2137193 A2 & NZ 579431 A & SG 179453 A1 & IL 200695 A & AR 65651 A1 & ZA 2009005564 A & MX 2009009447 A & US 2010/0075994 A1 & CN 101675060 A	１－１９

☑　Ｃ欄の続きにも文献が列挙されている。

☐　パテントファミリーに関する別紙を参照。

＊　引用文献のカテゴリー
「Ａ」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「Ｅ」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「Ｌ」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献（理由を付す）
「Ｏ」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「Ｐ」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願の日の後に公表された文献
「Ｔ」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「Ｘ」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Ｙ」特に関連のある文献であって、当該文献と他の１以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「＆」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日	国際調査報告の発送日
１３．１１．２０１２	２７．１１．２０１２

国際調査機関の名称及びあて先
日本国特許庁（ＩＳＡ／ＪＰ）
郵便番号１００－８９１５
東京都千代田区霞が関三丁目４番３号

特許庁審査官（権限のある職員）　４Ｐ　９５５０
谷尾　忍
電話番号　０３－３５８１－１１０１　内線　３４９２

Ｃ（続き）．　関連すると認められる文献

引用文献のカテゴリー＊	引用文献名　及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する請求項の番号
A	WO 2011/034832 A1 (SANOFI-AVENTIS) 2011.03.24, 文献全体、特に、請求項１、実施例１及び６４等参照 & AR 78172 A1	１－１９
A	WO 2011/034830 A1 (SANOFI-AVENTIS) 2011.03.24, 文献全体、特に、請求項１、実施例１及び１４等参照 & AR 78171 A1 & CA 2773555 A1 & AU 2010295802 A1 & CN 102498116 A & KR 2012068005 A & EP 2477994 A1 & US 2012/0184566 A1	１－１９
A	WO 2011/034828 A1 (SANOFI-AVENTIS) 2011.03.24, 文献全体、特に、請求項１、実施例１及び１２５等参照 & AR 78173 A1	１－１９
A	JP 2011-520890 A（メルク・シャープ・エンド・ドーム・コーポレイション）2011.07.21, 文献全体、特に、請求項１、スキーム１等及び表１等参照 & WO 2009/140163 A1 & AU 2009246626 A1 & CA 2723727 A1 & EP 2291078 A1 & US 2011/0124661 A1	１－１９
A	JP 2002-105085 A（山之内製薬株式会社）2002.04.10, 文献全体、特に、請求項１、実施例１等及び【００４９】－【００５１】等参照（ファミリーなし）	１－１９
A	F.M. SABBATINI et al, Metabotropic glutamate receptors: potential therapeutic applications of recently disclosed new chemical entities, EXPERT OPIN. THER. PATENTS, 2004, Vol.14, No.11, p.1593-1604, 文献全体、特に、図８及び９等参照	１－１９
A	JP 58-013587 A（株式会社大塚製薬工場）1983.01.26, 文献全体、特に、請求項１及び実施例１等参照 & JP 61-046476 B2	１－１９
A	JP 2004-149527 A（大塚製薬株式会社）2004.05.27, 文献全体、特に、請求項１及び実施例７７６等参照 & WO 2004/033463 A1 & CA 2497569 A1 & CA 2497569 C & AU 2003272979 A1 & AU 2003272979 B2 & BR 2003014344 A & EP 1555267 A1 & CN 1705670 A & CN 100366624 C & CN 101172981 A & RU 2326121 C2 & CN 101255170 A & CN 102532162 A & JP 4186065 B2 & ZA 2005001033 A	１－１９
A	WO 2011/014776 A1 (GLOBAL ALLIANCE FOR TB DRUG DEVELOPMENT) 2011.02.03, 文献全体、特に、請求項１及び図１８等参照 & CA 2769263 A1 & US 2011/0028466 A1 & US 8293734 B2 & AU 2010278779 A1 & EP 2459570 A1 & KR 2012084714 A & CN 102741259 A	１－１９

発明の属する分野の分類
C07D498/04(2006.01)i, A61K31/424(2006.01)i, A61K31/427(2006.01)i,
A61K31/4439(2006.01)i, A61K31/444(2006.01)i, A61K31/497(2006.01)i,
A61K31/501(2006.01)i, A61K31/506(2006.01)i, A61K31/5377(2006.01)i,
A61K31/695(2006.01)i, A61P25/08(2006.01)i, A61P25/18(2006.01)i, A61P25/20(2006.01)i,
A61P25/22(2006.01)i, A61P25/24(2006.01)i, A61P25/28(2006.01)i, A61P25/30(2006.01)i,
C07F7/10(2006.01)i

＜調査の対象について＞

請求項８のＲ^{3}の定義である「ヘテロアリール（該ヘテロアリールは、ハロゲン原子、アルキル、及びアリール（該アリールはハロゲン原子、Ｃ１－６アルキル、及びハロＣ１－６アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、」の「該ヘテロアリールは、ハロゲン原子、アルキル、及びアリール」は、日本語として意味不明である。

なお、本国際調査報告では、請求項８が引用する請求項１等の記載を参酌して、請求項８のＲ^{3}の定義である上記「ヘテロアリール（該ヘテロアリールは、ハロゲン原子、アルキル、及びアリール（該アリールはハロゲン原子、Ｃ１－６アルキル、及びハロＣ１－６アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、」との記載は、「ヘテロアリール（該ヘテロアリールは、ハロゲン原子、アルキル、及びアリール（該アリールはハロゲン原子、Ｃ１－６アルキル、及びハロＣ１－６アルキルからなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）からなる群より選ばれる１～３個の基で置換されてもよい。）、」の誤記であると解した上で、調査を行った。