

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】令和3年9月9日(2021.9.9)

【公表番号】特表2020-529439(P2020-529439A)

【公表日】令和2年10月8日(2020.10.8)

【年通号数】公開・登録公報2020-041

【出願番号】特願2020-505898(P2020-505898)

【国際特許分類】

C 0 7 D 273/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

C 0 7 D 413/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/5395 (2006.01)

C 0 7 D 417/10 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 495/10 (2006.01)

C 0 7 D 491/107 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

B 0 1 J 31/24 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 273/04

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 45/00

C 0 7 D 413/10 C S P

A 6 1 K 31/5395

C 0 7 D 417/10

C 0 7 D 471/04 1 0 8 A

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 495/10

C 0 7 D 491/107

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/551

B 0 1 J 31/24 Z

C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】令和3年7月30日(2021.7.30)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

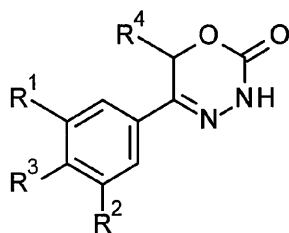
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式 (I) の化合物
【化 1】



式 (I)

(式中、

R¹は水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、C₁～C₃-アルキル基、C₁～C₃-ハロアルキル基およびC₁～C₃-ハロアルコキシ基から選択され；

R²は水素原子およびハロゲン原子から選択され；

R³は

場合により1個または2個の置換基で置換されたC₁～C₆-アルキル基（各置換基はヒドロキシ基、C₁～C₄-アルコキシ基および3～7員ヘテロシクロアルキル基から独立に選択される）；

場合によりC₁～C₄-アルコキシ基で置換されたC₂～C₆-アルケニル基、

場合によりヒドロキシ基で置換されたC₃～C₉-シクロアルキル基、

場合によりヒドロキシ基で置換されたC₅～C₉-シクロアルケニル基、

—O—、—S—、—S(O)—、S(O)₂および—NR⁹—から独立に選択される1、2または3個のヘテロ原子を含む3～9員ヘテロシクロアルキル基であって、

場合により—O—、—NR⁹—、—CH₂—、—CH₂—CH₂—、—O—CH₂—、—CH₂—O—、—NR⁹—CH₂—および—CH₂—NR⁹—から選択される架橋基をさらに含み；

場合により1、2または3個の置換基で置換されており、各置換基は、

ハロゲン原子；

オキソ(=O)基；

シアノ基；

ヒドロキシ基；

場合によりヒドロキシ基でさらに置換されたC₁～C₃-アルキル基；

C₁～C₃-ハロアルキル基；

C₁～C₃-アルコキシ基；

C₁～C₃-ハロアルコキシ基；

C(O)NR⁵R⁶基

およびNR⁵R⁶基

から独立に選択される3～9員ヘテロシクロアルキル基；

部分的に不飽和であり、場合により1、2または3個の置換基で置換された5～9員ヘテロシクロアルキル基（各置換基はオキソ基(=O)、C₁～C₃-アルキル基、—C(O)R⁵R⁶基およびハロゲン原子から独立に選択される）；

場合により1、2、3または4個の置換基で置換されたアリール基（各置換基はハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、C₁～C₃-アルキル基、C₁～C₃-ハロアルキル基、C₁～C₃-アルコキシ基、C₁～C₃-ハロアルコキシ基およびNR⁵R⁶基から独立に選択される）；

場合により1、2または3個の置換基で置換された単環式または二環式ヘテロアリール基（各置換基はハロゲン原子、C₁～C₃-アルキル基、シアノ基、C₁～C₃-ハロアルキル基、C₁～C₃-ヒドロキシアルキル基、C₁～C₃-アルコキシ基、ヒドロキシ基およびNR⁵R⁶基か

ら独立に選択され、但し、前記単環式ヘテロアリール基は4-ピリジルではない)、
 および NR^7R^8 基
 から選択され;

R^4 は水素原子および $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ -アルキル基から選択され;

R^5/R^6 は水素原子、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルキル基、 $-\text{C}_1\sim\text{C}_5$ -アルキレン- $\text{O}-\text{C}_1\sim\text{C}_5$ -アルキル基、 $-\text{C}_1\sim\text{C}_5$ -アルキレン- $\text{S}-\text{C}_1\sim\text{C}_5$ -アルキル基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ -シクロアルキル基および $\text{C}_3\sim\text{C}_5$ -ヘテロシクロアルキル基から独立に選択され;

R^7/R^8 は水素原子(但し、 $\text{R}^7=\text{R}^8$ =水素は除外される)、

$\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルキル基、

(これは場合により1、2、3または4個の置換基で置換されており、前記置換基はハロゲン原子、

シアノ基、

ヒドロキシ基、

$\text{C}(\text{O})\text{NR}^5\text{R}^6$ 基、

NR^5R^6 基、

$\text{C}_1\sim\text{C}_3$ -アルコキシ基、

場合により1個または2個の置換基で置換された $\text{C}_3\sim\text{C}_7$ -シクロアルキル基(前記置換基は $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ -アルキル基、オキソ($=\text{O}$)基、ヒドロキシ基および $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ -ヒドロキシアルキル基から独立に選択される);

それ自体が場合により $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ -アルキル基またはオキソ($=\text{O}$)基で置換された3~7員ヘテロシクロアルキル基

それ自体が場合により $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ -アルキル基で置換されたヘテロアリール基;
 から独立に選択される)

$-\text{C}_1\sim\text{C}_5$ -アルキレン- $\text{O}-\text{C}_1\sim\text{C}_5$ -アルキル基、

$-\text{C}_1\sim\text{C}_5$ -アルキレン- $\text{S}-\text{C}_1\sim\text{C}_5$ -アルキル基、

$-\text{C}_1\sim\text{C}_5$ -アルキレン- $\text{NR}^5-\text{C}_1\sim\text{C}_5$ -アルキル基、

場合によりヒドロキシ基で置換された $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ -シクロアルキル基、および

場合により1個または2個の置換基で置換された3~6員ヘテロシクロアルキル基(前記置換基は $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ -アルキル基およびヒドロキシ基から独立に選択される)

から独立に選択され、

R^9 は水素原子または $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ -アルキル基または結合である)

またはその立体異性体、互変異性体、N-オキシド、水和物、溶媒和物もしくは塩、またはこれらの混合物。

【請求項2】

R^1 が水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ -アルキル基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ -ハロアルキル基および $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ -ハロアルコキシ基から選択され;

R^2 が水素原子およびハロゲン原子から選択され;

R^3 が

場合によりヒドロキシ基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルコキシ基および3~7員ヘテロシクロアルキル基から選択される置換基で置換された $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ -アルキル基;

場合により $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルコキシ基で置換された $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ -アルケニル基;

場合によりヒドロキシ基で置換された $\text{C}_3\sim\text{C}_7$ -シクロアルキル基;

場合によりヒドロキシ基で置換された $\text{C}_5\sim\text{C}_7$ -シクロアルケニル基;

$-\text{O}-$ 、 $\text{S}(\text{O})_2$ および $-\text{NR}^9-$ から独立に選択される1個または2個のヘテロ原子を含む3~7員ヘテロシクロアルキル基であって、

場合により1個または2個の置換基で置換されており、各置換基が、

ハロゲン原子;

シアノ基;

ヒドロキシ基;

場合によりヒドロキシ基でさらに置換された $\text{C}_1\sim\text{C}_3$ -アルキル基;

$C_1 \sim C_3$ -アルコキシ基；

$C(O)NR^5R^6$ 基および

NR^5R^6 基

から独立に選択される3～7員ヘテロシクロアルキル基；

部分的に不飽和であり、場合により $C_1 \sim C_3$ -アルキル基およびハロゲン原子から選択される置換基で置換された、 $-O-$ 、 $-S-$ および $-NR^9-$ から選択されるヘテロ原子を含む5～7員ヘテロシクロアルキル基；

場合により1、2または3個の置換基で置換されたアリール基（各置換基はハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル基、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ基および NR^5R^6 基から独立に選択される）；

場合によりハロゲン原子、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル基、シアノ基、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ基および NR^5R^6 基から選択される置換基で置換された単環式または二環式ヘテロアリール基（但し、前記単環式ヘテロアリール基はピリジン-4-イル基ではない）；

および NR^7R^8 基

から選択され；

R^4 が水素原子および $C_1 \sim C_3$ -アルキル基から選択され；

R^5/R^6 が水素原子および $C_1 \sim C_6$ -アルキル基から独立に選択され；

R^7/R^8 が

水素原子（但し、 $R^7=R^8$ =水素は除外される）、

$C_1 \sim C_6$ -アルキル基（これは場合により1、2、3または4個の置換基で置換されており、前記置換基は

ハロゲン原子；

シアノ基；

ヒドロキシ基；

$C(O)NR^5R^6$ 基；

NR^5R^6 基；

$C_1 \sim C_3$ -アルコキシ基；

場合により1個または2個の置換基でさらに置換された $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキル基（前記置換基は $C_1 \sim C_3$ -アルキル基、オキソ（=O）基、ヒドロキシ基および $C_1 \sim C_3$ -ヒドロキシアルキル基から独立に選択される）；

場合により $C_1 \sim C_3$ -アルキル基でさらに置換された、 $-O-$ および $-NR^9-$ から独立に選択される1、2または3個のヘテロ原子を含む3～7員ヘテロシクロアルキル基；

場合により $C_1 \sim C_3$ -アルキル基でさらに置換されたヘテロアリール基から独立に選択される）

場合によりヒドロキシ基または $C_1 \sim C_3$ -アルキル基で置換された $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキル基、および

場合により1個または2個の置換基で置換された3～6員ヘテロシクロアルキル基（前記置換基は $C_1 \sim C_3$ -アルキル基およびヒドロキシ基から独立に選択される）

から独立に選択され、

R^9 が水素原子または $C_1 \sim C_3$ -アルキル基または結合である、

請求項1に記載の化合物またはその立体異性体、互変異性体、N-オキシド、水和物、溶媒和物もしくは塩、またはこれらの混合物。

【請求項3】

R^1 が水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル基、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル基および $C_1 \sim C_3$ -ハロアルコキシ基から選択され；

R^2 が水素原子およびハロゲン原子から選択され；

R^3 が

場合によりヒドロキシ基、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ基および3～7員ヘテロシクロアルキル基から選択される置換基で置換された $C_1 \sim C_6$ -アルキル基；

場合により $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ基で置換された $C_2 \sim C_6$ -アルケニル基；

場合によりヒドロキシ基で置換された $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキル基；

$C_5 \sim C_7$ -シクロアルケニル基；

-O-および-NR⁹-から独立に選択される1個または2個のヘテロ原子を含む3~7員ヘテロシクロアルキル基であって、

場合により1個または2個の置換基でさらに置換されており、各置換基が、

ハロゲン原子；

シアノ基；

ヒドロキシ基；

場合によりヒドロキシ基でさらに置換された $C_1 \sim C_3$ -アルキル基；

$C_1 \sim C_3$ -アルコキシ基および

C(O)NR⁵R⁶基

から独立に選択される3~7員ヘテロシクロアルキル基；

部分的に不飽和であり、場合により $C_1 \sim C_3$ -アルキル基およびハロゲン原子から選択される置換基で置換された、-O-および-NR⁹-から選択されるヘテロ原子を含む5~7員ヘテロシクロアルキル基、

場合により1、2または3個の置換基で置換されたアリール基（各置換基はハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル基、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル基およびNR⁵R⁶基から独立に選択される）、

場合によりハロゲン原子、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル基、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル基、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ基およびNR⁵R⁶基から選択される置換基で置換された単環式または二環式ヘテロアリール基（但し、前記単環式ヘテロアリール基はピリジン-4-イル基ではない）；

およびNR⁷R⁸基

から選択され；

R⁴が水素原子および $C_1 \sim C_3$ -アルキル基から選択され；

R⁵/R⁶が水素原子および $C_1 \sim C_6$ -アルキル基から独立に選択され；

R⁷/R⁸が

水素原子（但し、R⁷=R⁸=水素は除外される）、

$C_1 \sim C_6$ -アルキル基（これは場合により1、2、3または4個の置換基で置換されており、前記置換基は

ハロゲン原子；

シアノ基；

ヒドロキシ基；

NR⁵R⁶基；

$C_1 \sim C_3$ -アルコキシ基；

場合により1個または2個の置換基でさらに置換された $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキル基（前記置換基は $C_1 \sim C_3$ -アルキル基、オキソ(=O)基、ヒドロキシ基および $C_1 \sim C_3$ -ヒドロキシアルキル基から独立に選択される）；

場合により $C_1 \sim C_3$ -アルキル基でさらに置換された、-O-および-NR⁹-から独立に選択される1、2または3個のヘテロ原子を含む3~7員ヘテロシクロアルキル基；

場合により $C_1 \sim C_3$ -アルキル基でさらに置換されたヘテロアリール基から独立に選択される）；

場合によりヒドロキシ基または $C_1 \sim C_3$ -アルキル基で置換された $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキル基、および

場合により1個または2個の置換基で置換された3~6員ヘテロシクロアルキル基（前記置換基は $C_1 \sim C_3$ -アルキル基およびヒドロキシ基から独立に選択される）

から独立に選択され、

R⁹が水素原子または $C_1 \sim C_3$ -アルキル基または結合である、

請求項1に記載の化合物またはその立体異性体、互変異性体、N-オキシド、水和物、溶媒和物もしくは塩、またはこれらの混合物。

【請求項4】

R^1 が水素原子、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_3$ -アルキル基、 $C_1\sim C_3$ -ハロアルキル基および $C_1\sim C_3$ -ハロアルコキシ基から選択され；

R^2 が水素原子およびハロゲン原子から選択され；

R^3 が

場合によりヒドロキシ基、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ基および3～7員ヘテロシクロアルキル基から選択される置換基で置換された $C_1\sim C_6$ -アルキル基；

場合により $C_1\sim C_4$ -アルコキシ基で置換された $C_2\sim C_6$ -アルケニル基；

場合によりヒドロキシ基で置換された $C_4\sim C_6$ -シクロアルキル基；

$C_5\sim C_7$ -シクロアルケニル基；

-O-および-NR⁹-から独立に選択される1個または2個のヘテロ原子を含む3～6員ヘテロシクロアルキル基であって、

場合により1個または2個の置換基でさらに置換されており、各置換基が、

ハロゲン原子；

シアノ基；

ヒドロキシ基；

場合によりヒドロキシ基でさらに置換された $C_1\sim C_3$ -アルキル基

から独立に選択される3～6員ヘテロシクロアルキル基；

部分的に不飽和であり、場合により $C_1\sim C_3$ -アルキル基およびハロゲン原子から選択される置換基で置換された、-O-および-NR⁹-から選択されるヘテロ原子を含む5～6員ヘテロシクロアルキル基；

場合により1個または2個の置換基で置換されたアリール基（各置換基はハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、 $C_1\sim C_3$ -アルキル基、 $C_1\sim C_3$ -ハロアルキル基およびNR⁵R⁶基から独立に選択される）；

場合によりハロゲン原子、 $C_1\sim C_3$ -アルキル基、 $C_1\sim C_3$ -ハロアルキル基、 $C_1\sim C_3$ -アルコキシ基およびNR⁵R⁶基から選択される置換基で置換された単環式または二環式ヘテロアリール基（但し、前記単環式ヘテロアリール基はピリジン-4-イル基ではない）；

およびNR⁷R⁸基

から選択され；

R^4 が水素原子および $C_1\sim C_3$ -アルキル基から選択され；

R^5/R^6 が水素原子および $C_1\sim C_6$ -アルキル基から独立に選択され；

R^7/R^8 が

水素原子（但し、 $R^7=R^8$ =水素は除外される）、

$C_1\sim C_6$ -アルキル基（これは場合により1、2、3または4個の置換基で置換されており、前記置換基は

ハロゲン原子；

ヒドロキシ基；

$C_1\sim C_3$ -アルコキシ基；

場合により1個または2個の置換基でさらに置換された $C_3\sim C_6$ -シクロアルキル基（前記置換基は $C_1\sim C_3$ -アルキル基および $C_1\sim C_3$ -ヒドロキシアルキル基から独立に選択される）；

場合により $C_1\sim C_3$ -アルキル基でさらに置換された、-O-および-NR⁹-から独立に選択される1、2または3個のヘテロ原子を含む4～6員ヘテロシクロアルキル基；

場合により $C_1\sim C_3$ -アルキル基でさらに置換されたヘテロアリール基から独立に選択される）

場合によりヒドロキシ基または $C_1\sim C_3$ -アルキル基で置換された $C_3\sim C_6$ -シクロアルキル基；

場合により1個または2個の置換基で置換された3～6員ヘテロシクロアルキル基（前記置換基は $C_1\sim C_3$ -アルキル基およびヒドロキシ基から独立に選択される）

から独立に選択され、

R^9 が水素原子または $C_1\sim C_3$ -アルキル基または結合である、

請求項1に記載の化合物またはその立体異性体、互変異性体、N-オキシド、水和物、溶媒和物もしくは塩、またはこれらの混合物。

【請求項5】

R^1 が水素原子、ハロゲン原子、 $C_1\sim C_3$ -アルキル基および $C_1\sim C_3$ -ハロアルキル基から選択され；

R^2 が水素原子およびハロゲン原子から選択され；

R^3 が

場合により1個または2個の置換基で置換された $C_1\sim C_6$ -アルキル基（各置換基はヒドロキシ基、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ基および3～7員ヘテロシクロアルキル基から独立に選択される）；

場合により $C_1\sim C_3$ -アルコキシ基で置換された $C_2\sim C_6$ -アルケニル基；

場合によりヒドロキシ基で置換された $C_3\sim C_7$ -シクロアルキル基；

場合によりヒドロキシ基で置換された $C_5\sim C_6$ -シクロアルケニル基；

-O-および-NR⁹-から独立に選択される1、2または3個のヘテロ原子を含む3～6員ヘテロシクロアルキル基であって、

場合により1、2または3個の置換基で置換されており、各置換基が、

ハロゲン原子；

オキシ（=O）基；

シアノ基；

ヒドロキシ基；

場合によりヒドロキシ基でさらに置換された $C_1\sim C_3$ -アルキル基

から独立に選択される3～6員ヘテロシクロアルキル基；

部分的に不飽和であり、場合により1個または2個の置換基で置換された5～7員ヘテロシクロアルキル基（各置換基は $C_1\sim C_3$ -アルキル基およびハロゲン原子から独立に選択される）；

場合により1、2、3または4個の置換基で置換されたアリール基（各置換基はハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、 $C_1\sim C_3$ -アルキル基、 $C_1\sim C_3$ -ハロアルキル基、 $C_1\sim C_3$ -アルコキシ基、 $C_1\sim C_3$ -ハロアルコキシ基およびNR⁵R⁶基から独立に選択される）；

場合により1個または2個の置換基で置換された単環式または二環式ヘテロアリール基（各置換基はハロゲン原子、 $C_1\sim C_3$ -アルキル基、シアノ基、 $C_1\sim C_3$ -ハロアルキル基、 $C_1\sim C_3$ -アルコキシ基、ヒドロキシ基およびNR⁵R⁶基から独立に選択され、但し、前記単環式ヘテロアリール基はピリジン-4-イル基ではない）；

およびNR⁷R⁸基

から選択され；

R^4 が水素原子および $C_1\sim C_3$ -アルキル基から選択され；

R^5/R^6 が水素原子および $C_1\sim C_6$ -アルキル基から独立に選択され；

R^7/R^8 が

水素原子（但し、 $R^7=R^8$ =水素は除外される）、

$C_1\sim C_6$ -アルキル基（これは場合により1、2、3または4個の置換基で置換されており、前記置換基は

ハロゲン原子、

シアノ基、

ヒドロキシ基、

$C_1\sim C_3$ -アルコキシ基、

場合により1個または2個の置換基で置換された $C_3\sim C_7$ -シクロアルキル基（前記置換基は $C_1\sim C_3$ -アルキル基、ヒドロキシ基および $C_1\sim C_3$ -ヒドロキシアルキル基から独立に選択される）；

それ自体が場合により $C_1\sim C_3$ -アルキル基で置換された3～7員ヘテロシクロアルキル基；

および場合により $C_1 \sim C_3$ -アルキル基でさらに置換されたヘテロアリール基から独立に選択される)

場合によりヒドロキシ基で置換された $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル基、および

場合により1個または2個の置換基で置換された3~6員ヘテロシクロアルキル基(前記置換基は $C_1 \sim C_3$ アルキル基およびヒドロキシ基から独立に選択される)

から独立に選択され、

R^9 が水素原子または $C_1 \sim C_3$ -アルキル基または結合である、

請求項1に記載の化合物またはその立体異性体、互変異性体、N-オキシド、水和物、溶媒和物もしくは塩、またはこれらの混合物。

【請求項6】

R^1 が水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル基および $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル基から選択され；

R^2 が水素原子およびハロゲン原子から選択され；

R^3 が

-O-および-NR⁹-から独立に選択される1個または2個のヘテロ原子を含み、

場合により1個または2個の置換基でさらに置換された3~6員ヘテロシクロアルキル基(各置換基は

ハロゲン原子；

ヒドロキシ基；

および場合によりヒドロキシ基でさらに置換された $C_1 \sim C_3$ -アルキル基から独立に選択される)；

場合により1個または2個の置換基で置換されたアリール基(各置換基はハロゲン原子、ヒドロキシ基および $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル基から独立に選択される)；

場合によりハロゲン原子、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル基、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル基およびNR⁵R⁶基から選択される置換基で置換された単環式または二環式ヘテロアリール基(但し、前記単環式ヘテロアリール基はピリジン-4-イル基ではない)；

およびNR⁷R⁸基

から選択され；

R^4 が水素原子および $C_1 \sim C_3$ -アルキル基から選択され；

R^5/R^6 が水素原子および $C_1 \sim C_3$ -アルキル基から独立に選択され；

R^7/R^8 が

水素原子(但し、 $R^7 = R^8 =$ 水素は除外される)、

$C_1 \sim C_6$ -アルキル基(これは場合により1または2、3または4個の置換基で置換されており、前記置換基は

ハロゲン原子；

ヒドロキシ基；

$C_1 \sim C_3$ -アルコキシ基；

場合により1個または2個の置換基でさらに置換された $C_3 \sim C_5$ -シクロアルキル基(前記置換基は $C_1 \sim C_3$ -アルキル基および $C_1 \sim C_3$ -ヒドロキシアルキル基から独立に選択される)；

場合により $C_1 \sim C_3$ -アルキル基でさらに置換された、-O-および-NR⁹-から独立に選択される1個または2個のヘテロ原子を含む5~6員ヘテロシクロアルキル基、

場合により $C_1 \sim C_3$ -アルキル基でさらに置換されたヘテロアリール基から独立に選択される)；

場合によりヒドロキシ基または $C_1 \sim C_3$ -アルキル基で置換された $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル基

場合により1個または2個の置換基で置換された4~5員ヘテロシクロアルキル基(前記置換基は $C_1 \sim C_3$ アルキル基およびヒドロキシ基から独立に選択される)

から独立に選択され、

R^9 が水素原子または $C_1 \sim C_3$ -アルキル基または結合である、

請求項1に記載の化合物またはその立体異性体、互変異性体、N-オキシド、水和物、溶媒和物もしくは塩、またはこれらの混合物。

【請求項7】

R^1 が CF_3 およびフッ素原子から選択され；

R^2 が水素原子であり；

R^3 が

場合によりハロゲン原子および $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル基から選択される置換基で置換されたアリール基、

$C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル基および NR^5R^6 基から選択される置換基で置換された単環式ヘテロアリール基、

および NR^7R^8 基

から選択され；

R^4 が水素原子およびメチル基から選択され；

R^5/R^6 が水素原子およびメチル基から独立に選択され；

R^7/R^8 が

水素原子（但し、 $R^7=R^8$ =水素は除外される）、

$C_1 \sim C_3$ -アルキル基（これは場合により1、2または4個の置換基で置換されており、前記置換基は

ハロゲン原子、ヒドロキシ基およびメトキシ基

から独立に選択される）

から独立に選択される、

請求項1に記載の化合物またはその立体異性体、互変異性体、N-オキシド、水和物、溶媒和物もしくは塩、またはこれらの混合物。

【請求項8】

以下の群：

5- [4- (4, 4-ジフルオロピペリジン-1-イル) -3-フルオロフェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4-クロロ-3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4'-フルオロ-2- (トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [3-フルオロ-4- (モルホリン-4-イル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [3-フルオロ-4- (4-フルオロ-4-メチルピペリジン-1-イル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [3-フルオロ-4- (4-フルオロピペリジン-1-イル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- (4'-フルオロ-2-メチルビフェニル-4-イル) -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- (3', 4'-ジフルオロ-2-メチルビフェニル-4-イル) -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- (4'-フルオロ-2, 2'-ジメチルビフェニル-4-イル) -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (3, 6-ジヒドロ-2H-ピラン-4-イル) -3-メチルフェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [3-メチル-4- (1H-ピラゾール-4-イル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [3-メチル-4- (6-オキソ-1, 6-ジヒドロピリジン-3-イル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [3-メチル-4- (ピリジン-3-イル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3,

- 4-オキサジアジン-2-オン、
5-[3-メチル-4-(ピリミジン-5-イル)フェニル]-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
5-(3'-フルオロ-2-メチルピフェニル-4-イル)-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
(rac)-6-メチル-5-(3,4,5-トリフルオロフェニル)-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
(rac)-5-[3,5-ジフルオロ-4-(モルホリン-4-イル)フェニル]-6-メチル-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
(rac)-5-{3,5-ジフルオロ-4-[(2S)-2-メチルモルホリン-4-イル]フェニル}-6-メチル-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
(rac)-5-(4-ブロモフェニル)-6-メチル-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン
(rac)-6-メチル-5-[4-(モルホリン-4-イル)フェニル]-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
5-[3,5-ジフルオロ-4-(モルホリン-4-イル)フェニル]-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
2-(モルホリン-4-イル)-5-(2-オキソ-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-5-イル)ベンゾニトリル、
3-クロロ-2-(モルホリン-4-イル)-5-(2-オキソ-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-5-イル)ベンゾニトリル、
5-{4-[2,6-ジメチルモルホリン-4-イル]-3-フルオロフェニル}-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
(6S)-5-(3-フルオロ-4-モルホリノフェニル)-6-メチル-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
(6S)-5-(3,5-ジフルオロ-4-モルホリノフェニル)-6-メチル-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
5-[4-(3,3-ジフルオロピロリジン-1-イル)-3-フルオロフェニル]-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
5-(2-メチルピフェニル-4-イル)-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
5-[3-メチル-4-(2-メチルピリミジン-5-イル)フェニル]-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
5-[3-メチル-4-(1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル)フェニル]-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
5-(2,4'-ジフルオロピフェニル-4-イル)-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
5-[4'-クロロ-2-(トリフルオロメチル)ピフェニル-4-イル]-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
5-[4-(6-メチルピリジン-3-イル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
5-[4-(ピリジン-3-イル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
5-[4'-アミノ-2-(トリフルオロメチル)ピフェニル-4-イル]-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
5-[3'-ヒドロキシ-4'-メチル-2-(トリフルオロメチル)ピフェニル-4-イル]-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
5-{3-(トリフルオロメチル)-4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]フェニル}-3,6-ジヒドロ-2H-1,3,4-オキサジアジン-2-オン、
5-[4'-フルオロ-3'-ヒドロキシ-2-(トリフルオロメチル)ピフェニル-4-

イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [5'-アミノ-2', 4'-ジフルオロ-2- (トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [4'-アミノ-3'-フルオロ-2- (トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [4- (6-アミノピリジン-3-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [3'-アミノ-4'-クロロ-2- (トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [3'-アミノ-4'-メチル-2- (トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [3'-アミノ-2'-フルオロ-2- (トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [4'-アミノ-2'-フルオロ-2- (トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [4- (1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [4- (3-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [4- (1H-インダゾール-6-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [4- (5-フルオロ-6-メチルピリジン-3-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [4- (1, 2-チアゾール-4-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 1-メチル-5- [4- (2-オキソ-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-5-イル) -2- (トリフルオロメチル) フェニル] -1H-ピロール-2-カルボニトリル、
 5- [2, 4'-ビス (トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [4- (1, 3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [4- (2-メトキシ-6-メチルピリジン-3-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [4- (2-メチル-1, 3-チアゾール-5-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [4'- (メチルアミノ) -2- (トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [3'-アミノ-4'-フルオロ-2- (トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [4-フルオロ-3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [3', 4', 5'-トリフルオロ-2- (トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [2', 5'-ジフルオロ-2- (トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [3'-アミノ-4'-フルオロ-2- (トリフルオロメトキシ) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [3', 4'-ジフルオロ-2- (トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
 5- [4- (1H-インドール-6-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6

- ー ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [4- (2-メチルプロパ-1-エン-1-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [2', 3'-ジフルオロ-2- (トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [4- (モルホリン-4-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [4- (ブチルアミノ) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [4- (エチルアミノ) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [4- (1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) -3- (トリフルオロメトキシ) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [4- (プロピルアミノ) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [4- (6-メチルピリジン-3-イル) -3- (トリフルオロメトキシ) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [4'-クロロ-2- (トリフルオロメトキシ) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [4- (アゼチジン-1-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [4- (1-メチル-1H-ベンズイミダゾール-6-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [4- (ペンチルアミノ) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [4- (1-メチル-1H-インダゾール-6-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [4'-フルオロ-2- (トリフルオロメトキシ) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [3-フルオロ-4- (6-フルオロピリジン-3-イル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [3-フルオロ-4- (3-メチルピリジン-4-イル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [3-フルオロ-4- (2-メチルピリジン-4-イル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- (4'-アミノ-2-フルオロビフェニル-4-イル) -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- (2-フルオロ-2'-メチルビフェニル-4-イル) -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- (2'-クロロ-2, 4'-ジフルオロビフェニル-4-イル) -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [4- (シクロペンタ-1-エン-1-イル) -3-フルオロフェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- (2'-エチル-2-フルオロビフェニル-4-イル) -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- [3-フルオロ-4- (6-メトキシピリジン-3-イル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- (2, 4'-ジフルオロ-3'-メチルビフェニル-4-イル) -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、
5- (2-フルオロ-3'-メチルビフェニル-4-イル) -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3,

4-オキサジアジン-2-オン、

5-(2-フルオロ-4'-メチルビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-(2-フルオロビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-[4-(2-アミノピリジン-4-イル)-3-フルオロフェニル]-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-(3'-アミノ-2-フルオロビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-[4'-(ジフルオロメチル)-2-フルオロビフェニル-4-イル]-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-[3-フルオロ-4-(ピリジン-4-イル)フェニル]-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-[3-フルオロ-4-(2-メチルピリミジン-5-イル)フェニル]-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-[3-フルオロ-4-(2-メトキシピリジン-4-イル)フェニル]-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-[3-フルオロ-4-(2-メチルピリジン-3-イル)フェニル]-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-[3-フルオロ-4-(6-メチルピリジン-3-イル)フェニル]-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-(2, 2', 4', 5'-テトラフルオロビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-(2, 2', 3', 4'-テトラフルオロビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-(2, 2', 5'-トリフルオロビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

2'-フルオロ-4'-(2-オキソ-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-5-イル)ビフェニル-4-カルボニトリル、

5-(2'-アミノ-2-フルオロビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-(3'-アミノ-2-フルオロ-4'-メチルビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-(2-フルオロ-3'-ヒドロキシビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-(2-フルオロ-4'-ヒドロキシビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-(2-フルオロ-2'-ヒドロキシビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-(2, 3', 4'-トリフルオロビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-[3-フルオロ-4-(ピリジン-3-イル)フェニル]-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-(2, 2', 3'-トリフルオロビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-(2, 3', 5'-トリフルオロビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-(2, 2', 4'-トリフルオロビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5-(2-フルオロ-2', 4'-ジメチルビフェニル-4-イル)-3, 6-ジヒドロ-2H

−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−(2, 3′−ジフルオロ−4′−メチルビフェニル−4−イル)−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−(2, 2′−ジフルオロビフェニル−4−イル)−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−(2, 2′, 6′−トリフルオロビフェニル−4−イル)−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−(2−フルオロ−2′−メトキシビフェニル−4−イル)−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−(2, 3′−ジフルオロビフェニル−4−イル)−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−[3−フルオロ−4−(4−メチルピリジン−3−イル)フェニル]−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

(rac)−5−(3−フルオロ−4−モルホリノフェニル)−6−メチル−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

(6S)−6−メチル−5−[4−(モルホリン−4−イル)−3−(トリフルオロメチル)フェニル]−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

(6S)−5−(−[(3−クロロ−4−(モルホリン−4−イル)−5−(トリフルオロメチル)フェニル) −] −6−メチル−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

6S)−5−(−[(4−クロロ−3−(トリフルオロメチル)フェニル) −] −6−メチル−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

(6S)−5−(−[(4−フルオロ−3−(トリフルオロメチル)フェニル) −] −6−メチル−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−[4−クロロ−3−(トリフルオロメトキシ)フェニル]−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−(4−クロロ−3−メチルフェニル)−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

(rac)−6−メチル−5−(4−モルホリノ−3−(トリフルオロメチル)フェニル)−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−{4−[1−メチル−3−(トリフルオロメチル)−1H−ピラゾール−4−イル]−3−(トリフルオロメチル)フェニル}−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−[4−(3, 5−ジメチル−1H−ピラゾール−4−イル)−3−(トリフルオロメチル)フェニル]−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−[4−(3, 5−ジメチル−1, 2−オキサゾール−4−イル)−3−(トリフルオロメチル)フェニル]−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−{3−(トリフルオロメチル)−4−[3−(トリフルオロメチル)−1H−ピラゾール−4−イル]フェニル}−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−[4−(1−エチル−1H−ピラゾール−4−イル)−3−(トリフルオロメチル)フェニル]−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−{4−[シクロペンチル(メチル)アミノ]−3−(トリフルオロメチル)フェニル}−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−[4−(1−メチル−1, 2, 3, 6−テトラヒドロピリジン−4−イル)−3−(トリフルオロメチル)フェニル]−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−{4−[ブチル(メチル)アミノ]−3−(トリフルオロメチル)フェニル}−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

(6S)−5−[4′−フルオロ−2−(トリフルオロメチル)ビフェニル−4−イル]−6−メチル−3, 6−ジヒドロ−2H−1, 3, 4−オキサジアジン−2−オン、

5−[4−(シクロペンチルアミノ)−3−(トリフルオロメチル)フェニル]−3, 6−

ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (シクロペンチルアミノ) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [3'-フルオロ-2- (トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4-メチル-3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [3-メトキシプロパ-1-エン-1-イル] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(rac) -5- [4'-ヒドロキシ-2- (トリフルオロメチル) -2', 3', 4', 5'-テトラヒドロ [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (5, 6-ジヒドロ-2H-ピラン-3-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [3, 3-ジメチルブタ-1-エン-1-イル] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {3- (トリフルオロメチル) -4- [5- (トリフルオロメチル) チオフェン-3-イル] フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [1- (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-4-イル] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (プロパ-1-エン-2-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (1-ベンゾチオフェン-2-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (2, 5-ジヒドロフラン-3-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (シクロペンタ-1-エン-1-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (1-エチル-1H-イミダゾール-4-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

3-メチル-5- [4- (2-オキソ-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-5-イル) -2- (トリフルオロメチル) フェニル] チオフェン-2-カルボニトリル、

5- {4- [1- (プロパン-2-イル) -1H-ピラゾール-4-イル] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(rac) -5- [4- (ピシクロ [2. 2. 1] ヘプタ-2-エン-2-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [2'-フルオロ-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {3- (トリフルオロメチル) -4- [5- (トリフルオロメチル) チオフェン-2-イル] フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (5-メチルピリジン-2-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (5-フルオロピリジン-2-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (5-クロロピリジン-2-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (ピリジン-2-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [2'- (ジフルオロメチル) -2-フルオロ [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- (2, 4'-ジフルオロ-2'-メチル [1, 1'-ビフェニル] -4-イル) -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

2'-フルオロ-2-メチル-4'- (2-オキソ-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-5-イル) [1, 1'-ビフェニル] -4-カルボニトリル、

5- [4- (2-メチルプロパ-1-エン-1-イル) -3- (トリフルオロメトキシ) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- [4- (2-アミノピリジン-4-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -6-メチル-5- [4- (ピリジン-4-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -6-メチル-5- [4- (6-メチルピリジン-3-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- [2'-フルオロ-4'-メチル-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -6-メチル-5- [2', 4', 5'-トリフルオロ-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -6-メチル-5- [2', 3', 4'-トリフルオロ-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- [2', 5'-ジフルオロ-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

4'- [(6S) -6-メチル-2-オキソ-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-5-イル] -2'- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -2-カルボニトリル、

(6S) -5- [4- (1H-インドール-5-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- [4'-ヒドロキシ-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- [3'-ヒドロキシ-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- [3'-アミノ-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- [2', 4'-ジフルオロ-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- [3'-フルオロ-4'-メチル-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- [2'-フルオロ-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- [2'-メトキシ-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- [3'-フルオロ-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -6-メチル-5- [4- (4-メチルピリジン-3-イル) -3- (トリフルオロメ

チル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -6-メチル-5- [4- (3-メチルピリジン-4-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -6-メチル-5- [4- (2-メチルピリジン-4-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- [4- (1H-インドール-6-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- [4- (6-メトキシピリジン-3-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- [4'-メトキシ-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -6-メチル-5- [4'-メチル-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- {4- [1- (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-4-イル] -3- (トリフルオロメチル) -フェニル} -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [1- (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-4-イル] -3- (トリフルオロメチル) -フェニル} -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4'-フルオロ-2- (トリフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [1- (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-4-イル] -3-フルオロ-5- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {3- (ジフルオロメチル) -4- [1- (ジフルオロメチル) -1H-ピラゾール-4-イル] フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -6-メチル-5- {4- [(モルホリン-4-イル) メチル] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [(モルホリン-4-イル) メチル] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [2- (ジフルオロメチル) -4'-フルオロ [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4'-クロロ-2- (ジフルオロメチル) [1, 1'-ビフェニル] -4-イル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [3- (ジフルオロメチル) -4- (6-メチルピリジン-3-イル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (シクロペンタ-1-エン-1-イル) -3- (ジフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [3- (ジフルオロメチル) -4- (1H-ピラゾール-4-イル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (3-ヒドロキシ-3-メチルアゼチジン-1-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(rac) -5- [4- { [3, 3, 3-トリフルオロ-2-ヒドロキシプロピル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [(オキサン-4-イル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [(シス/トランス) -3-ヒドロキシシクロブチル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

、

5- {4- [(rac) -2, 4-ジメチルアゼチジン-1-イル] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [(シスまたはトランス) -2, 4-ジメチルアゼチジン-1-イル] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [3, 3, 3-トリフルオロ-2 (S) -ヒドロキシプロピル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [(トランス) -4-ヒドロキシシクロヘキシル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [(シクロプロピルメチル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [(3-メチルオキセタン-3-イル) メチル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

- {4- [(3-メトキシプロピル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- ({ [(rac) -オキソラン-2-イル] メチル} アミノ) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [2 (R) -2-ヒドロキシプロピル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [(3R) -3-ヒドロキシブチル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [(2S) -2-ヒドロキシプロピル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [(1-ヒドロキシシクロブチル) メチル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [(3-メチルブチル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [(2-メチルプロピル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [(2-メトキシエチル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [エチル (メチル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (tert-ブチルアミノ) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- ({ [(2R) -オキソラン-2-イル] メチル} アミノ) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [(ピラジン-2-イル) メチル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [(2S) -1-ヒドロキシブタン-2-イル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (3-ヒドロキシピペリジン-1-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン (ラセミ混合物)、

(rac) -1- [4- (2-オキソ-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-5-イル) -2- (トリフルオロメチル) フェニル] ピペリジン-3-カルボキサミド、

5- {4- [(3-ヒドロキシ-2, 2-ジメチルプロピル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (4, 4-ジフルオロピペリジン-1-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [(1R, 2R, 4R) -ビスクロ [2. 2. 1] ヘプタン-2-イル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [(3S) -3-ヒドロキシピロリジン-1-イル] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(rac) -5- {4- [(2-ヒドロキシ-3-メトキシプロピル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [(1-メチル-1H-ピラゾール-5-イル) メチル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [(1H-ピラゾール-3-イル) メチル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [2- (1H-ピラゾール-1-イル) エチル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

1- [4- (2-オキソ-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-5-イル) -2- (トリフルオロメチル) フェニル] ピペリジン-4-カルボニトリル、

(rac) -5- {4- [(1-シクロプロピルエチル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(rac) -5- {4- [(2-エトキシプロピル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン

(rac) -5- {4- [(2-メトキシプロピル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン

5- [4- (3-エトキシアゼチジン-1-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [(ピリミジン-2-イル) メチル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [(オキソラン-3-イル) メチル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン (ラセミ混合物)

5- [4- { [(2S) -4-ヒドロキシブタン-2-イル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(rac) -5- [4- { [(6-オキソピペリジン-3-イル) メチル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(rac) -5- [4- { [(2, 2-ジメチルシクロプロピル) メチル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- ({ [1- (ヒドロキシメチル) シクロブチル] メチル} アミノ) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [(2S) -2- (ヒドロキシメチル) アゼチジン-1-イル] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

3-メチル-1- [4- (2-オキソ-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-5-イル) -2- (トリフルオロメチル) フェニル] アゼチジン-3-カルボニトリル、

5- [4- (3-アザビスクロ [3. 1. 0] ヘキサン-3-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (4-エチル-4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

4- [4- (2-オキソ-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-5-イル) -2- (トリフルオロメチル) アニリノ] ブタンニトリル、

6- [4- (2-オキソ-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-5-イル) -2- (トリフルオロメチル) フェニル] -2λ⁶-チア-6-アザスピロ [3. 3] ヘプタン-2, 2-ジオン、

N²- [4- (2-オキソ-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-5-イル) -2- (トリフルオロメチル) フェニル] グリシンアミド、

5- {4- [(3R) -3-ヒドロキシピロリジン-1-イル] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [(2-メトキシ-2-メチルプロピル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン

5- [4- ({ [(2S) -オキソラン-2-イル] メチル} アミノ) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [(2-エトキシエチル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- { [(1S, 2R) -2-ヒドロキシシクロペンチル] アミノ} -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [(オキセタン-3-イル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {3- (ジフルオロメチル) -4- [1- (プロパン-2-イル) -1H-ピラゾール-4-イル] フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [3-フルオロ-4- (モルホリン-4-イル) -5- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -6-メチル-5- {3- (トリフルオロメチル) -4- [3- (トリフルオロメチル) -1H-ピラゾール-1-イル] フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -6-メチル-5- {3- (トリフルオロメチル) -4- [4- (トリフルオロメチル) -1H-イミダゾール-1-イル] フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (3-メトキシプロピル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (2-メチルプロピル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (3, 3-ジメチルブチル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (プロパン-2-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(rac) -5- {4- [オキサン-3-イル] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(トランス) -5- {4- [4-ヒドロキシシクロヘキシル] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン (トランス異性体)、

(シス) -5- {4- [4-ヒドロキシシクロヘキシル] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- {4- [(2-アミノエチル) アミノ] -3- (トリフルオロメチル) フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン-塩酸との塩、

5- {4- [1-アミノ-3-アザビシクロ [3. 1. 0] ヘキサン-3-イル] -3- (トリフルオロメチル) -フェニル} -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オ

ン-塩酸との塩、

5- [4- (メチルアミノ) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -6-メチル-5- [4- (4-メチルピペラジン-1-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

5- [4- (2-ヒドロキシプロパン-2-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン、

(6S) -5- [4- (3, 3-ジフルオロアゼチジン-1-イル) -3- (トリフルオロメチル) フェニル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン
および

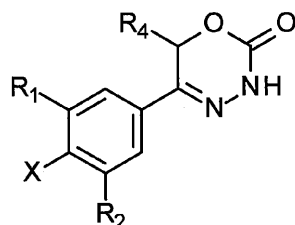
(6S) -5- [4- (3-ヒドロキシ-3-メチルアゼチジン-1-イル) -3- (トリフルオロメチル) -フェニル] -6-メチル-3, 6-ジヒドロ-2H-1, 3, 4-オキサジアジン-2-オン

またはその立体異性体、互変異性体、N-オキシド、水和物、溶媒和物もしくは塩、またはこれらの混合物から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項9】

請求項1から8のいずれか一項に記載の一般式 (I) の化合物を調製する方法であって、一般式 (II) の中間体化合物：

【化2】



(II)

(式中、

XはCl、Br、I、または(C₁~C₄-アルキルスルホニル)オキシ、(C₁~C₄-フルオロアルキルスルホニル)オキシおよび(フェニルスルホニル)オキシから選択される脱離基であり、(フェニルスルホニル)オキシに存在するフェニルは場合により1、2、3、4または5個の置換基で置換されており、これらの置換基の各々はハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁~C₄-アルキルおよびC₁~C₄-アルコキシから独立に選択され；

R¹は水素原子、フッ素原子、シアノ基、C₁~C₃-アルキル基、C₁~C₃-ハロアルキル基およびC₁~C₃-ハロアルコキシ基から選択され；

R²は水素原子、フッ素原子から選択され；

R⁴は水素原子およびC₁~C₃-アルキル基から選択される)を、

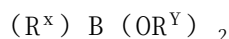
遷移金属触媒カップリング条件下で、

前記式 (II) の中間体化合物を、式 (IIIa) のボロン酸



(IIIa)、

式



(IIIb)

のボロン酸エステル、

および式

(R^x) BF₄

(IIIc)

のテトラフルオロホウ酸塩

から選択される有機ホウ素化合物

(式中、

R^xは

場合により1個または2個の置換基で置換されたC₁～C₆-アルキル基（各置換基はヒドロキシ基、C₁～C₄-アルコキシ基および3～7員ヘテロシクロアルキル基から独立に選択される）；

場合によりC₁～C₄-アルコキシ基で置換されたC₂～C₆-アルケニル基；

場合によりヒドロキシ基で置換されたC₅～C₉-シクロアルケニル基、

—O—、—S—、—S(O)—、S(O)₂および—NR⁹—から独立に選択される1、2または3個のヘテロ原子を含む3～9員ヘテロシクロアルキル基であって、

場合により—O—、—NR⁹—、—CH₂—、—CH₂—CH₂—、—O—CH₂—、—CH₂—O—、—NR⁹—CH₂—および—CH₂—NR⁹—から選択される架橋基をさらに含み；

場合により1、2または3個の置換基で置換されており、各置換基は、

ハロゲン原子

オキソ(=O)基；

シアノ基；

ヒドロキシ基；

場合によりヒドロキシ基でさらに置換されたC₁～C₃-アルキル基；

C₁～C₃-ハロアルキル基；

C₁～C₃-アルコキシ基；

C₁～C₃-ハロアルコキシ基；

C(O)NR⁵R⁶基および

NR⁵R⁶基

から独立に選択される3～9員ヘテロシクロアルキル基、

部分的に不飽和であり、場合により1、2または3個の置換基で置換された5～9員ヘテロシクロアルキル基（各置換基はオキソ基(=O)、C₁～C₃-アルキル基、—C(O)NR⁵R⁶基およびハロゲン原子から独立に選択される）、

場合により1、2、3または4個の置換基で置換されたアリール基（各置換基はハロゲン原子、ヒドロキシ基、シアノ基、C₁～C₃-アルキル基、C₁～C₃-ハロアルキル基、C₁～C₃-アルコキシ基、C₁～C₃-ハロアルコキシ基およびNR⁵R⁶基から独立に選択される）、

場合により1、2または3個の置換基で置換された単環式または二環式ヘテロアリール基（各置換基はハロゲン原子、C₁～C₃-アルキル基、シアノ基、C₁～C₃-ハロアルキル基、C₁～C₃-アルコキシ基、ヒドロキシ基およびNR⁵R⁶基から独立に選択され、但し、前記単環式ヘテロアリール基はピリジン-4-イル基ではない）

であり；

R^yはC₁～C₆-アルキルである、あるいは2つの残基R^yが一緒になって、C₂～C₆-アルキレン基となる）と

塩基、および

ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(0)、酢酸パラジウム(II)/トリスシクロヘキシルホスフィン、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム、ビス(ジフェニルホスフィンフェロセニル)パラジウム(II)クロリド、1,3-ビス(2,6-ジイソプロピルフェニル)イミダゾール-2-イリデン(1,4-ナフトキノ)パラジウムダイマー、アリル(クロロ)(1,3-ジメシチル-1,3-ジヒドロ-2H-イミダゾール-2-イリデン)パラジウム、酢酸パラジウム(II)/ジシクロヘキシル(2',4',6'-トリイソプロピル-ビフェニル-2-イル)ホスフィン、[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)クロリドモノジクロロメタン付加物、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェ

ロセン] ジクロロパラジウム (II)、クロロ (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-1, 1'-ビフェニル) [2-(2'-アミノ-1, 1'-ビフェニル)] パラジウム (II)、酢酸パラジウム (II) 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-1, 1'-ビフェニル) [2-(2'-アミノ-1, 1'-ビフェニル)] パラジウム (II)

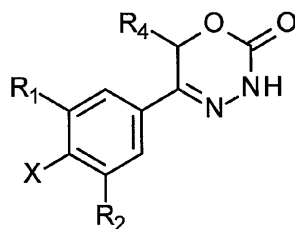
から選択されるパラジウム触媒、

および場合により追加の配位子の存在下で反応させることによって反応させるステップ Aを含む、

または

一般式 (II) の中間体化合物：

【化 3】



(II)

(式中、

R^4 は上に定義される意味を有し、

XはFまたはClであり、但し、XがClである場合、 R^1 または R^2 はFであることができず；

R^1 は水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル基、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル基および $C_1 \sim C_3$ -ハロアルコキシ基から選択され；

但し、XがClである場合、 R^1 はフッ素原子であることができず；

R^2 は水素原子およびハロゲン原子から選択され；

但し、XがClである場合、 R^2 はフッ素原子であることができず；

さらに但し、 R^1 と R^2 の少なくとも一方は電子吸引効果を発揮し；

R^4 は水素原子および $C_1 \sim C_3$ -アルキル基から選択される)を、

場合により HNR^7R^8 および環原子として1個のN-Hを特徴とする環状アミン (前記環状アミンはそれぞれ環原子として1個のN-Hを含有する3~9員ヘテロシクロアルカン、部分不飽和3~9員ヘテロシクロアルカンおよびヘテロアレーンから選択される) から選択される遊離塩基または塩としての対応するアミン

(式中、

R^7/R^8 は

水素原子 (但し、 $R^7=R^8$ =水素は除外される)、

$C_1 \sim C_6$ -アルキル基

(これは場合により1、2、3または4個の置換基で置換されており、前記置換基は

ハロゲン原子、

シアノ基、

ヒドロキシ基、

C(O)NR⁵R⁶基、

NR⁵R⁶基、

$C_1 \sim C_3$ -アルコキシ基、

場合により1個または2個の置換基で置換された $C_3 \sim C_7$ -シクロアルキル基 (前記置換基は $C_1 \sim C_3$ -アルキル基、オキソ (=O) 基、ヒドロキシ基および $C_1 \sim C_3$ -ヒドロキシアルキル基から独立に選択される) ；

それ自体が場合により $C_1 \sim C_3$ -アルキル基またはオキシ(=O)基で置換された3~7員ヘテロシクロアルキル基、

それ自体が場合により $C_1 \sim C_3$ -アルキル基で置換されたヘテロアリール基から独立に選択される)

$-C_1 \sim C_5$ -アルキレン- $O-C_1 \sim C_5$ -アルキル基、

$-C_1 \sim C_5$ -アルキレン- $S-C_1 \sim C_5$ -アルキル基、

$-C_1 \sim C_5$ -アルキレン- $NR^5-C_1 \sim C_5$ -アルキル基、

場合によりヒドロキシ基で置換された $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル基、および

場合により1個または2個の置換基で置換された3~6員ヘテロシクロアルキル基(前記置換基は $C_1 \sim C_3$ アルキル基およびヒドロキシ基から独立に選択される)

から独立に選択される)、

環原子として1個のN-Hを含有する3~9員ヘテロシクロアルカン(上記の R^3 について定義される3~9員ヘテロシクロアルキル基に対応する環状アミンとして理解されるべきであり、但し、環原子として1個のN-Hを含有する)、

環原子として1個のN-Hを含有する部分不飽和3~9員ヘテロシクロアルカン(上記の R^3 について定義される部分不飽和3~9員ヘテロシクロアルキル基に対応する環状アミンとして理解されるべきであり、但し、環原子として1個のN-Hを含有する)、および

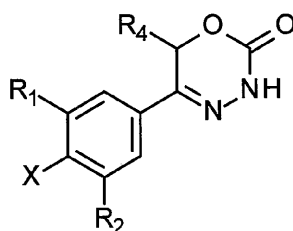
環原子として1個のN-Hを含有するヘテロアレーン(上記の R^3 について定義されるヘテロアリール基に対応する環状アミンとして理解されるべきであり、但し、環原子として1個のN-Hを含有する)と

場合により塩基の存在下、および場合により不活性溶媒の存在下、室温~160°Cに及ぶ温度で反応させるステップBを含む、

または

一般式(II)の中間体化合物:

【化4】



(II)

(式中、

XはCl、Br、I、または($C_1 \sim C_4$ -アルキルスルホニル)オキシ、($C_1 \sim C_4$ -フルオロアルキルスルホニル)オキシおよび(フェニルスルホニル)オキシから選択される脱離基であり、(フェニルスルホニル)オキシに存在するフェニルは場合により1、2、3、4または5個の置換基で置換されており、これらの置換基の各々はハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキルおよび $C_1 \sim C_4$ -アルコキシから独立に選択され;

R^1 は水素原子、フッ素原子、シアノ基、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル基、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル基および $C_1 \sim C_3$ -ハロアルコキシ基から選択され;

R^2 は水素原子、フッ素原子から選択され;

R^4 は水素原子および $C_1 \sim C_3$ -アルキル基から選択される)を、

場合により HNR^7R^8 および環原子として1個のN-Hを特徴とする環状アミン(前記環状アミンはそれぞれ環原子として1個のN-Hを含有する3~9員ヘテロシクロアルカン、部分不飽和3~9員ヘテロシクロアルカンおよびヘテロアレーンから選択される)から選択される遊離塩基または塩としての対応するアミン

(式中、
 R^7/R^8 は

水素原子 (但し、 $R^7=R^8$ =水素は除外される)、

$C_1\sim C_6$ -アルキル基

(これは場合により1、2、3または4個の置換基で置換されており、前記置換基はハロゲン原子、シアノ基、ヒドロキシ基、 $C(O)NR^5R^6$ 基、 NR^5R^6 基、

$C_1\sim C_3$ -アルコキシ基、

場合により1個または2個の置換基で置換された $C_3\sim C_7$ -シクロアルキル基 (前記置換基は $C_1\sim C_3$ -アルキル基、オキソ (=O) 基、ヒドロキシ基および $C_1\sim C_3$ -ヒドロキシアルキル基から独立に選択される) ;

それ自体が場合により $C_1\sim C_3$ -アルキル基またはオキソ (=O) 基で置換された3~7員ヘテロシクロアルキル基、

それ自体が場合により $C_1\sim C_3$ -アルキル基で置換されたヘテロアリール基から独立に選択される)

- $C_1\sim C_5$ -アルキレン-O- $C_1\sim C_5$ -アルキル基、

- $C_1\sim C_5$ -アルキレン-S- $C_1\sim C_5$ -アルキル基、

- $C_1\sim C_5$ -アルキレン- NR^5 - $C_1\sim C_5$ -アルキル基、

場合によりヒドロキシ基で置換された $C_3\sim C_6$ -シクロアルキル基、および

場合により1個または2個の置換基で置換された3~6員ヘテロシクロアルキル基 (前記置換基は $C_1\sim C_3$ -アルキル基およびヒドロキシ基から独立に選択される)

から独立に選択される)、

環原子として1個のN-Hを含有する3~9員ヘテロシクロアルカン (上記の R^3 について定義される3~9員ヘテロシクロアルキル基に対応する環状アミンとして理解されるべきであり、但し、環原子として1個のN-Hを含有する)、

環原子として1個のN-Hを含有する部分不飽和3~9員ヘテロシクロアルカン (上記の R^3 について定義される部分不飽和3~9員ヘテロシクロアルキル基に対応する環状アミンとして理解されるべきであり、但し、環原子として1個のN-Hを含有する)、および

環原子として1個のN-Hを含有するヘテロアレーン (上記の R^3 について定義されるヘテロアリール基に対応する環状アミンとして理解されるべきであり、但し、環原子として1個のN-Hを含有する) と

塩基、およびパラジウム触媒、配位子の存在下、不活性溶媒中、および不活性溶媒の存在下、60℃~160℃に及ぶ温度で

反応させるステップCを含む、

前記ステップのうちの1つを使用して式 (I) の化合物を得るための方法。

【請求項10】

化合物 (II) について： R^1 がトリフルオロメチルであり、 R^2 が水素原子であり、

ステップAについて：

鈴木カップリング条件が使用され、パラジウム触媒がクロロ (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-1, 1'-ビフェニル) [2-(2'-アミノ-1, 1'-ビフェニル)] パラジウム (II) であり、配位子が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である、および/または

ステップBについて：

2つの残基 R^V が一緒になって、 $-C(CH_3)_2-C(CH_3)_2-$ となりピナコールエステルを形成し、塩基が炭酸カリウムまたは酢酸カリウムである、および/または

ステップCについて：

パラジウム触媒がトリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム (0) であり、配位子が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-1, 1'-ビフェニルまたは2, 2'-ビス (ジフェニルホスフィノ)-1, 1'-ビナフタレンである、

を含む、請求項9に記載の一般式 (I) の化合物を調製する方法。

【請求項 1 1】

請求項1から8のいずれか一項に記載の一般式（I）の化合物と、1種または複数の薬学的に許容される賦形剤とを含む医薬組成物。

【請求項 1 2】

・請求項1から8のいずれか一項に記載の一般式（I）の化合物である1種または複数の第1の有効成分、および

・1種または複数のさらなる有効成分

を含む医薬組成物。

【請求項 1 3】

疾患を治療または予防するための請求項1から8のいずれか一項に記載の一般式（I）の化合物を含む組成物。

【請求項 1 4】

前記疾患が過剰増殖性疾患である、請求項13に記載の組成物。

【請求項 1 5】

前記過剰増殖性疾患が、がん疾患である、請求項14に記載の組成物。

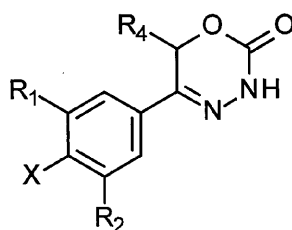
【請求項 1 6】

前記がん疾患が、脳がん、乳がん、子宮頸がん、AML、肺がん、皮膚がん、食道癌、卵巣がん、膵臓がんおよび前立腺がんである、請求項15に記載の組成物。

【請求項 1 7】

一般式（II）の構造を有する化合物：

【化 5】



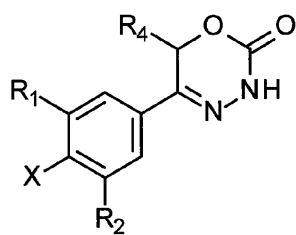
(II)

（式中、R¹がフッ素原子またはトリフルオロメチル基であり、R²が水素原子またはメチル基であり、およびR⁴は請求項1から8のいずれか一項に記載の一般式（I）の化合物について定義される意味を有し、Xはフッ素原子、塩素原子、臭素原子またはヨウ素原子である）。

【請求項 1 8】

請求項1から7のいずれか一項に記載の一般式（I）の化合物を調製するための一般式（I）の化合物

【化 6】



(II)

（式中、 R^1 、 R^2 および R^4 は請求項1から7のいずれか一項に記載の一般式（I）の化合物について定義される意味を有し、 X はフッ素原子、塩素原子、臭素原子またはヨウ素原子または脱離基である）
の使用。