

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成25年1月10日(2013.1.10)

【公表番号】特表2008-540595(P2008-540595A)

【公表日】平成20年11月20日(2008.11.20)

【年通号数】公開・登録公報2008-046

【出願番号】特願2008-511622(P2008-511622)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/427	(2006.01)
C 0 7 D	277/20	(2006.01)
C 0 7 D	277/34	(2006.01)
C 0 7 D	277/38	(2006.01)
C 0 7 D	417/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/426	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/541	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/02	(2006.01)
A 6 1 P	13/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/18	(2006.01)
A 6 1 P	25/36	(2006.01)
A 6 1 P	25/32	(2006.01)
A 6 1 P	7/10	(2006.01)
A 6 1 P	23/02	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/427	
C 0 7 D	277/34	C S P
C 0 7 D	277/38	
C 0 7 D	417/12	
A 6 1 K	31/426	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/541	
A 6 1 K	31/496	
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	25/24	

A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 25/14
A 6 1 P 25/16
A 6 1 P 25/08
A 6 1 P 11/06
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 13/02
A 6 1 P 13/10
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 17/00
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 25/18
A 6 1 P 25/36
A 6 1 P 25/32
A 6 1 P 7/10
A 6 1 P 23/02

【誤訳訂正書】

【提出日】平成24年11月15日(2012.11.15)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】請求項1

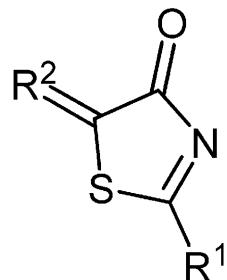
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【請求項1】

それぞれ場合により、その純粋な立体異性体のうちの1つ、殊に鏡像異性体又はジアステレオマー、そのラセミ化合物の形か、任意の混合比での、立体異性体、殊に鏡像異性体及び(又は)ジアステレオマー、の混合物の形か、それ相応の塩の形か、あるいはそれ相応の溶媒和化合物の形である、一般式I、

【化1】



I

{式中、

R¹は置換されていないか又は少なくとも1回置換された不飽和又は飽和の、場合により少なくとも1つのヘテロ原子を環メンバーとして有する環状脂肪族基(この基は、置換されていないか又は少なくとも1回置換された単環状又は多環状環系と縮合してよい。)を示すか;

置換されていないか又は少なくとも1回置換されたアリール基(この基は置換されていないか又は少なくとも1回置換された単環状又は多環状環系と縮合してよい。)を示すか;

- $\text{N R}^3 \text{R}^4$ 基を示すか；

- $\text{N R}^5 - \text{C}(=\text{O}) - \text{R}^6$ 基を示すか

あるいは $\text{N R}^7 - \text{C}(=\text{O}) - \text{N R}^8 \text{R}^9$ 基を示し；

R^2 は置換されていないか又は少なくとも 1 回置換された不飽和又は飽和の、場合により少なくとも 1 つのヘテロ原子を環メンバーとして有する環状脂肪族基（この基は置換されていないか又は少なくとも 1 回置換された単環状又は多環状環系と縮合していくよい。）を示すか；

$\text{C H} - \text{U} - \text{X}$ を示すか；

$\text{C H} - \text{C H}_2 - \text{V} - \text{Y}$ 、 $\text{C H} - \text{C H}(\text{C H}_3) - \text{V} - \text{Y}$ 、 $\text{C H} - \text{C H C l} - \text{V} - \text{Y}$ 、 $\text{C H} - \text{C H B r} - \text{V} - \text{Y}$ 、

$\text{C H} - \text{C H F} - \text{V} - \text{Y}$ 又は $\text{C H} - \text{C H}(\text{O H}) - \text{V} - \text{Y}$ を示すか；

あるいは $\text{C H} - \text{C H} = \text{C}(\text{C H}_3) - \text{W} - \text{Z}$ 、 $\text{C H} - \text{C H} = \text{C H} - \text{W} - \text{Z}$ 、 $\text{C H} - \text{C}(\text{C H}_3) = \text{C H} - \text{W} - \text{Z}$ 、

$\text{C H} - \text{C}$ （フェニル）= $\text{C H} - \text{W} - \text{Z}$ 、 $\text{C H} - \text{C B r} = \text{C H} - \text{W} - \text{Z}$ 、 $\text{C H} - \text{C C l} = \text{C H} - \text{W} - \text{Z}$ 、

$\text{C H} - \text{C F} = \text{C H} - \text{W} - \text{Z}$ 、 $\text{C H} - \text{C}(\text{O H}) = \text{C H} - \text{W} - \text{Z}$ 、 $\text{C H} - \text{C H}_2 - \text{C H}_2 - \text{W} - \text{Z}$ 、 $\text{C H} - \text{C H}_2 - \text{C H}(\text{C H}_3) - \text{W} - \text{Z}$ 又は $\text{C H} - \text{C H}(\text{C H}_3) - \text{C H}_2 - \text{W} - \text{Z}$ を示し；

この際 U 、 V 及び W はそれぞれ存在していなくともよいか又はそれぞれ相互に無関係に、 O 、 S 、 $\text{N}(\text{H})$ 、 $\text{N}(\text{C H}_3)$ 、 $\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)$ 及び $\text{N}[\text{C H}(\text{C H}_3)_2]$ より成る群から選ばれた基を示し；

R^3 は線状又は分枝状の、飽和又は不飽和の、置換されていないか又は少なくとも 1 回置換された、場合により少なくとも 1 つのヘテロ原子を鎖メンバーとして有する脂肪族基を示すか；

置換されていないか又は少なくとも 1 回置換された、不飽和又は飽和の、場合により少なくとも 1 つのヘテロ原子を環メンバーとして有する環状脂肪族基を（この基は置換されていないか又は少なくとも 1 回置換された単環状又は多環状環系と縮合していくよい。）を示すか；

あるいは 置換されていないか又は少なくとも 1 回置換されたアリール基又はヘテロアリール基（これらの基は置換されていないか又は少なくとも 1 回置換された単環状又は多環状環系と縮合していくよいか、及び（又は）線状又は分枝状の、置換されていないか又は少なくとも 1 回置換されたアルキレン基、アルケニレン基又はアルキニレン基を介して結合していくよい。）を示し；

R^4 は水素基を示すか

線状又は分枝状の、飽和又は不飽和の、置換されていないか又は少なくとも 1 回置換された、場合により少なくとも 1 つのヘテロ原子を環メンバーとして有する脂肪族基を示し；

R^5 、 R^7 及び R^9 は相互に無関係にそれぞれ水素基を示すか；

あるいは 線状又は分枝状の、飽和又は不飽和の、置換されていないか又は少なくとも 1 回置換された脂肪族基を示し；

R^6 及び R^8 は相互に無関係にそれぞれ、

置換されていないか又は少なくとも 1 回置換されたアリール基又はヘテロアリール基（これらの基は置換されていないか又は少なくとも 1 回置換された単環状又は多環状環系と縮合していくよい。）を示し；

X は置換されていないか又は少なくとも 1 回置換された単環状又は多環状環系と縮合していくよいか、及び（又は）同一か又は異なる置換基 R^{10} で置換されていてよいアリール基又はヘテロアリール基を示し；

Y は置換されていないか又は少なくとも 1 回置換された単環状又は多環状環系と縮合していくよいか、及び（又は）同一か又は異なる置換基 R^{11} で置換されていてよいアリール基又はヘテロアリール基を示し；

Z は線状又は分枝状の、飽和又は不飽和の、置換されていないか又は少なくとも 1 回置換

された脂肪族基を示すか；

あるいは置換されていないか又は少なくとも1回置換された単環状又は多環状環系と縮合していくよいか、及び(又は)同一か又は異なる置換基R^{1~2}で置換されていてよいアリール基又はヘテロアリール基を示し；

R^{1~0}、R^{1~1}及びR^{1~2}は相互に無関係にそれぞれ、

F、C1、Br、I、-CN、-CF₃、-SF₅、-OH、-O-C_{1~10}-アルキル、-O-C_{2~10}-アルケニル、-NH₂、-NO₂、-O-CF₃、-S-CF₃、-SH、-S-C_{1~5}-アルキル、-C_{1~10}-アルキル、-C(=O)-OH、-C(=O)-O-C_{1~5}-アルキル、-O-C(=O)-C_{1~5}-アルキル、-NH-C_{1~5}-アルキル、-N(C_{1~5}-アルキル)₂、-NH-C(=O)-O-C_{1~5}-アルキル、-C(=O)-H、-C(=O)-C_{1~5}-アルキル、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH-C_{1~5}-アルキル、-C(=O)-N-(C_{1~5}-アルキル)₂、-S(=O)₂-C_{1~5}-アルキル、-S(=O)₂-フェニル、-O-S(=O)₂-フェニル、-NH-S(=O)₂-C_{1~5}-アルキル、シクロヘキシリル、シクロペンチル、ピリジニル、ピリダジニル、-(CH₂)-ベンゾ[b]フラニル、-O-フェニル、-O-ベンジル、フェニル及びベンジルより成る群から選ばれた基(上記ピリジニル、シクロペンチル、シクロヘキシリル、ピリダジニル、-S(=O)₂-フェニル、-O-S(=O)₂-フェニル、-O-フェニル、-O-ベンジル、フェニル、-(CH₂)-ベンゾ[b]フラニル及びベンジル基の環状部分のそれぞれは置換されていてよい。)を示すか；

-C(=O)-NR^{1~3}-(CH₂)_m-NR^{1~4}-R^{1~5}基(式中、mは0、1、2、3、4又は5である。)を示すか；

あるいはC(=O)-R^{1~6}基を示し；

R^{1~3}及びR^{1~4}は相互に無関係にそれぞれ、

水素原子を示すか；

あるいは線状又は分枝状の、飽和又は不飽和の、置換されていないか又は少なくとも1回置換された脂肪族基を示し；

R^{1~5}は置換されていないか又は少なくとも1回置換されたアリール基又はヘテロアリール基(これらの基は置換されていないか又は少なくとも1回置換された単環状又は多環状環系と縮合していくよい。)を示し；

そして

R^{1~6}は置換されていないか又は少なくとも1回置換された不飽和又は飽和の、場合により少なくとも1つのヘテロ原子を環メンバーとして有する環状脂肪族基(この基は置換されていないか又は少なくとも1回置換された単環状又は多環状環系と縮合していくよい。)を示す。}

で表わされる2、5-ジ置換されたチアゾール-4-オン誘導体少なくとも1種の痛みの予防及び(又は)治療用医薬の製造への使用。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】請求項1~4

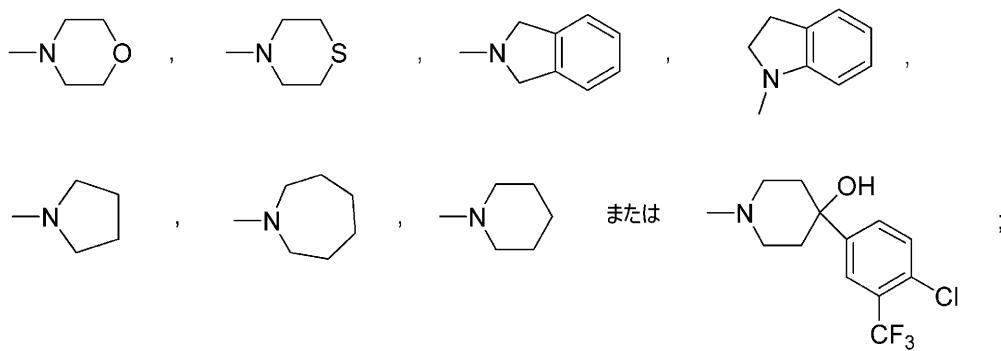
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【請求項1~4】

R¹が次の基

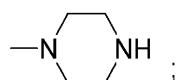
【化5】



のうちの1つを示すか

次の基

【化6】



(式中、-NH基の水素原子がメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、s-ブチル、イソブチル、t-ブチル、ピリジニル、ピリダジニル、[1、2、5]-チアシアゾリル、ベンジル及びフェニルより成る群から選ばれた置換基で置換されていてよく、この際ピリジニル、ピリダジニル、[1、2、5]-チアシアゾリル、ベンジル及びフェニル基の環状部分のそれぞれはF、Cl、Br、-CF₃、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、s-ブチル、イソブチル、t-ブチル、-O-CH₃、-O-C₂H₅、-O-CF₃及び-S-CF₃から成る群より相互に無関係に選択された1、2又は3個の置換基で置換されていてよい。)

を示すか；

フェニル及びナフチルより成る群から選ばれた基（これらの基は場合によりそれぞれ、-OH、-O-CH₃及び-O-C₂H₅から成る群より相互に無関係に選択された1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてよい。）を示すか；

NR³R⁴基を示すか；あるいはNR⁷-C(=O)-NR⁸R⁹基を示し；

R²が1、3-ジヒドロ-インドール-2-オニル基又は1、3-ジヒドロ-インドール-2-チオニル基を示すか；

CH-Xを示すか；

CH-CH₂-Y、CH-CH(CH₃)-Y又はCH-CH(OH)-Yを示すか；

あるいはCH-CH=C(CH₃)-Z、CH-CH=CH-Z、CH-CH=CH-S-Z、CH-C(CH₃)=CH-Z、CH-C(フェニル)=CH-Z、CH-CBr=CH-Z、CH-CCl=CH-Z、CH-CF=CH-Z、CH-CH₂-CH₂-Z、CH-CH₂-CH(CH₃)-Z又はCH-CH(CH₃)-CH₂-Z基を示すか；

R³がメチル、-CH₂-O-CH₃、-CH₂-S-CH₃、エチル、-CH₂-CH₂-S-CH₃、-CH₂-CH₂-O-CH₃、-CH₂-CH₂-N(CH₃)-CH₃、n-プロピル、-CH₂-CH₂-CH₂-S-CH₃、-CH₂-CH₂-CH₂-N(CH₃)-CH₃、イソプロピル、n-ブチル、s-ブチル、イソブチル、t-ブチル、(1、1)-ジメチル-プロピル、n-ペンチル、s-ペンチル、n-ヘキシル及びn-ヘプチルより成る群から選ばれた基を示すか；

あるいはフェニル、ナフチル、ベンジル、(1、3)-ベンゾジオキソリル及び(1、4)-ベンゾジオキサンリルより成る群から選ばれた基（これらの基はF、Cl、Br、-CF₃、-O-CF₃、-O-CH₃、-OC₂H₅、メチル、エチル、n-プロピル、イソ

プロピル、n - ブチル及びt - ブチルから成る群より相互に無関係に選択された1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてよい。)を示し；

R⁴が水素基を示すか；

あるいはメチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、s - ブチル、イソブチル、t - ブチル、(1、1) - ジメチル - プロピル、n - ペンチル、s - ペンチル、n - ヘキシル及びn - ヘプチルより成る群から選ばれた基を示し；

R⁷及びR⁸がそれぞれ水素基を示し；

R⁹がフェニル基(この基はF、C1、Br及び-CF₃から成る群より相互に無関係に選択された1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてよい。)を示し；

Xがフェニル、ナフチル、フェナントレニル、(1、3) - ベンゾジオキソリル、(1、4) - ベンゾジオキサニル、チオフェニル、フラニル、ピリジニル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、キノリニル及びイソキノリニルより成る群から選ばれた基(これらの基は1、2、3、4又は5個の同一か又は異なる置換基R¹⁰で置換されていてよい。)を示し；

Yがフェニル基又はナフチル基(これらの基は1、2、3、4又は5個の同一か又は異なる置換基R¹¹で置換されていてよい。)を示し；

Zがメチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、s - ブチル、イソブチル、t - ブチル、(1、1) - ジメチル - プロピル、n - ペンチル、s - ペンチル、n - ヘキシル、n - ヘプチル及びn - オクチルより成る群から選ばれた基を示し；

あるいはフェニル基又はナフチル基(これらの基は1、2、3、4又は5個の同一か又は異なる置換基R¹²で置換されていてよい。)を示し；

R¹⁰がF、C1、Br、I、-CF₃、-SF₅、-OH、-O - CH₃、-O - C₂H₅、-O - CH₂ - CH₂ - CH₃、-O - CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₃、-O - C(CH₃)₃、-O - CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₃、-O - CH₂ - CH₂ - C(CH₃)₃、-O - CH = CH₂、-O - CH₂ - CH = CH₂、-NH₂、-O - CF₃、-S - CF₃、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、n - ペンチル、n - ヘキシル、n - ヘプチル、n - オクチル、-C(=O) - OH、-C(=O) - O - CH₃、-C(=O) - O - C₂H₅、-C(=O) - O - C(CH₃)₃、-N(CH₃)₂、-N(C₂H₅)₂、-NH - CH₃、-NH - C₂H₅、-NH - C(=O) - CH₃、-O - S(=O)₂ - フェニル、-O - フェニル、-O - ベンジル及びフェニルより成る群から選ばれた基を示すか；-C(=O) - NR¹³ - (CH₂)_m - NR¹⁴ - R¹⁵基(式中、mは0、1、2又は3を示す。)を示すか；

あるいはC(=O) - R¹⁶基を示し；

R¹¹がF、C1、Br、I、-CN、-CF₃、-SF₅、-OH、-O - CH₃、-O - C₂H₅、-O - CH₂ - CH₂ - CH₃、-O - CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₃、-O - C(CH₃)₃、-O - CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₃、-O - CH₂ - C(CH₃)₃、-O - CH = CH₂、-O - CH₂ - CH = CH₂、-NH₂、-NO₂、-O - CF₃、-S - CF₃、-SH、-S - CH₃、-S - C₂H₅、-S - CH₂ - CH₂ - CH₃、-S - CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₃、-S - C(CH₃)₃、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、s - ブチル、t - ブチル、n - ペンチル、n - ヘキシル、n - ヘプチル及びn - オクチルより成る群から選ばれた基を示し；

R¹²がF、C1、Br、I、-CN、-CF₃、-SF₅、-OH、-O - CH₃、-O - C₂H₅、-O - CH₂ - CH₂ - CH₃、-O - CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₃、-O - C(CH₃)₃、-O - CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₃、-O - CH₂ - C(CH₃)₃、-O - CH = CH₂、-O - CH₂ - CH = CH₂、-NH₂、-NO₂、-O - CF₃、-S - CF₃、-SH、-S - CH₃、-S - C₂H₅、-S - CH₂ - CH₂ - CH₃、-S - CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₃、-S - C(CH₃)₃、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、s - ブチル、

t - ブチル、n - ペンチル、n - ヘキシル、n - ヘプチル及びn - オクチルより成る群から選ばれた基を示し；

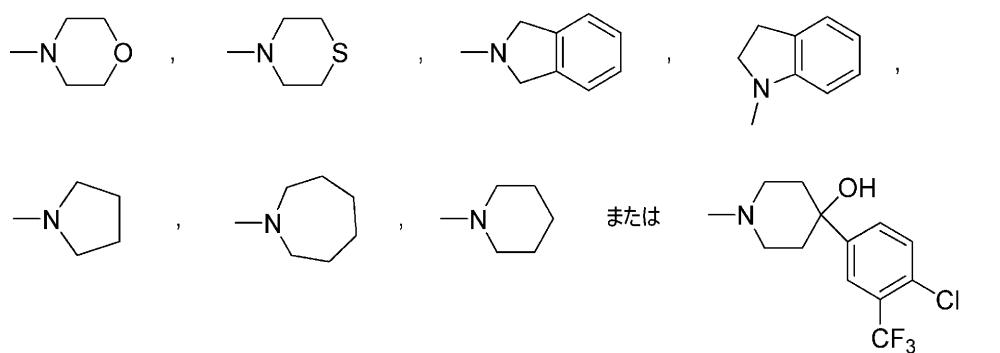
R^{1~3} 及び R^{1~4} がそれぞれ水素基を示し；

R^{1~5} がフェニル、ナフチル、チオフェニル、フラニル、ピリジニル、チアゾリル及びオキサゾリルより成る群から選ばれた基（これらの基は場合によりそれぞれF、C1、Br、I、-CN、-CF₃、-SF₅、-O-CF₃、-S-CF₃、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、s - ブチル、イソブチル及びt - ブチルから成る群より相互に無関係に選択された1、2、3、4又は5個の置換基で置換されていてよい。）を示し；

そして

R^{1~6} が次の基

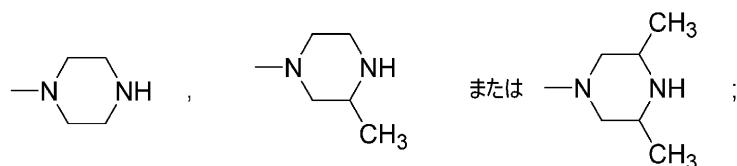
【化7】



のうちの1つを示すか

あるいは次の基

【化8】



のうちの1つ、

（式中、-NH基の水素原子がピリジニル、ピリダジニル、[1、2、5]-チアジアゾリル、ベンジル及びフェニルより成る群から選ばれた置換基で置換されていてよく、この際ピリジニル、ピリダジニル、[1、2、5]-チアジアゾリル、ベンジル及びフェニル基の環状部分のそれぞれはF、C1、Br、-CF₃、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、s - ブチル、イソブチル、t - ブチル、-O-CH₃、-O-C₂H₅、-O-CF₃及び-S-CF₃から成る群より相互に無関係に選択された1、2又は3個の置換基で置換されていてよい。）

を示し；

それぞれ場合により、その純粋な立体異性体のうちの1つ、そのラセミ化合物の形か、任意の混合比での、立体異性体、殊に鏡像異性体及び（又は）ジアステレオマー、の混合物の形か、それぞれ相応の塩の形か、あるいはそれぞれ相応の溶媒和化合物の形である、請求項1~13のいずれか1つに記載の化合物の使用。

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】請求項15

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【請求項15】

1 5 - [3 - (4 - メトキシ - フェニル) - プト - 2 - エニリデン] - 2 - モルホリン

- 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
2 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - フェンエチリデン - チアゾル - 4 - オン
3 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (2 - o - トリル - エチリデン) - チアゾル - 4 - オン
4 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン
5 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (3 - フェニル - ブチリデン) - チアゾル - 4 - オン
6 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (3 - フェニル - プロピリデン) - チアゾル - 4 - オン
7 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - アリリデン] - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
8 N - [4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - 4 - オキソ - 4 H - チアゾル - 5 - イリデンメチル) - フェニル] - アセトアミド
9 5 - ベンゾ [1、3] ジオキソル - 5 - イルメチレン - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
10 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (3 - m - トリル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン
11 5 - (3 - ヨード - 4、5 - ジメトキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
12 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (3 - フェニルスルファニル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン
13 5 - (3 - ベンジルオキシ - 4 - メトキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
14 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
15 N - [4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - 4 - オキソ - 4 H - チアゾル - 5 - イリデンメチル) - フェニル] - アミン
16 5 - (4 - ブトキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
17 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (4 - フェノキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
18 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (3 - フェノキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
19 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (3 - p - トリル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン
20 5 - (3 - ベンジルオキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
21 5 - (4 - ベンジルオキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
22 2 - チオモルホリン - 4 - イル - 5 - (2 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
23 5 - (4 - ブロモ - ベンジリデン) - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
24 2 - チオモルホリン - 4 - イル - 5 - (4 - トリフルオロメトキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
25 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
26 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - オクチリデン - チアゾル - 4 - オン
27 5 - (4 - ベンジルオキシ - 3 - メトキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4

- イル - チアゾル - 4 - オン

2 8 5 - (3、4 - ビス - ベンジルオキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

2 9 5 - ブチリデン - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

3 0 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

3 1 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン

3 2 5 - ヘキシリデン - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

3 3 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (3 - p - トリル - プト - 2 - エニリデン) - チアゾル - 4 - オン

3 4 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - プト - 2 - エニリデン] - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

3 5 5 - (4 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチレン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

3 6 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (4 - トリフルオロメトキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

3 7 2 - [4 - (3 - メトキシ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン

3 8 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - アリリデン] - 2 - [4 - (3 - メトキシ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン

3 9 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - ベンジリデン) - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

4 0 5 - [3 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル) - アリリデン] - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

4 1 5 - ナフタレン - 1 - イルメチレン - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

4 2 5 - ベンジリデン - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

4 3 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - [3 - (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - プト - 2 - エニリデン] - チアゾル - 4 - オン

4 4 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - [3 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - プト - 2 - エニリデン] - チアゾル - 4 - オン

4 5 5 - (3 - メチル - ブチリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

4 6 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (2 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

4 7 5 - (4 - ブロモ - ベンジリデン) - 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン

4 8 5 - ベンジリデン - 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン

4 9 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - ナフタレン - 2 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン

5 0 5 - (2、3 - ジフェニル - アリリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

5 1 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - フェナントレン - 9 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン

5 2 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - キノリン - 3 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン

5 3 2 - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

5 4 5 - ナフタレン - 2 - イルメチレン - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
5 5 2 - [4 - (4 - メトキシ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン
5 6 2 - [4 - (2 - クロロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン
5 7 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - 2 - (4 - フェニル - ピペラジン - 1 - イル) - チアゾル - 4 - オン
5 8 5 - デシリデン - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
5 9 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - アリリデン] - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
6 0 2 - (2 - モルホリン - 4 - イル - 4 - オキソ - 4 H - チアゾル - 5 - イリデンメチル) - 安息香酸
6 1 5 - (2 - プロモ - 3 - フェニル - アリリデン) - 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
6 2 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - アリリデン] - 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
6 3 2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
6 4 2 - (4 - フェニル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - キノリン - 3 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
6 5 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (2 - メチル - 3 - フェニル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン
6 6 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - ナフタレン - 1 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
6 7 5 - (2 - クロロ - 3 - フェニル - アリリデン) - 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
6 8 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - ベンジリデン) - 2 - (4 - フェニル - ピペラジン - 1 - イル) - チアゾル - 4 - オン
6 9 5 - フェナントレン - 9 - イルメチレン - 2 - (4 - フェニル - ピペラジン - 1 - イル) - チアゾル - 4 - オン
7 0 5 - (6 - メトキシ - ナフタレン - 2 - イルメチレン) - 2 - (4 - フェニル - ピペラジン - 1 - イル) - チアゾル - 4 - オン
7 1 5 - ナフタレン - 1 - イルメチレン - 2 - (4 - フェニル - ピペラジン - 1 - イル) - チアゾル - 4 - オン
7 2 5 - (4 - プロモ - ベンジリデン) - 2 - (4 - フェニル - ピペラジン - 1 - イル) - チアゾル - 4 - オン
7 3 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - 2 - (4 - フェニル - ピペラジン - 1 - イル) - チアゾル - 4 - オン
7 4 2 - (4 - フェニル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - (2 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
7 5 3 - (4 - オキソ - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - 4 H - チアゾル - 5 - イリデン) - 1、3 - ジヒドロ - インドール - 2 - オン
7 6 3 - (2 - モルホリン - 4 - イル - 4 - オキソ - 4 H - チアゾル - 5 - イリデン) - 1、3 - ジヒドロ - インドール - 2 - オン
7 7 2 - [4 - (2 - フルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
7 8 5 - (4 - t - ブチル - ベンジリデン) - 2 - [4 - (2 - フルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
7 9 2 - [4 - (2 - フルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (3 - フ

エニル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン

8 0 5 - [3 - (4 - t - プチル - フェニル) - アリリデン] - 2 - [4 - (2 - フルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン

8 1 2 - [4 - (2 - フルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

8 2 2 - [4 - (2 - フルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - トリフルオロメトキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

8 3 5 - (2 - クロロ - 3 - フェニル - アリリデン) - 2 - [4 - (2 - フルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン

8 4 2 - [4 - (2 - フルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - ナフタレン - 1 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン

8 5 5 - (2 - クロロ - 3 - フェニル - アリリデン) - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

8 6 3 - (4 - オキソ - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - 4H - チアゾル - 5 - イリデンメチル) - 安息香酸

8 7 4 - (4 - オキソ - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - 4H - チアゾル - 5 - イリデンメチル) - 安息香酸

8 8 5 - { 3 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - カルボニル] - ベンジリデン } - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

8 9 5 - { 4 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - カルボニル] - ベンジリデン } - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

9 0 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - キノリン - 3 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン

9 1 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

9 2 2 - (2、3 - ジヒドロ - インドール - 1 - イル) - 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

9 3 2 - (2、3 - ジヒドロ - インドール - 1 - イル) - 5 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

9 4 5 - [4 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - ベンジリデン] - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

9 5 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

9 6 1 - [4 - オキソ - 5 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - 4、5 - ジヒドロ - チアゾル - 2 - イル] - 3 - (2 - トリフルオロメチル - フェニル) - 尿素

9 7 2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - キノリン - 3 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン

9 8 2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - ナフタレン - 2 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン

9 9 2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - (3 - フェノキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

1 0 0 2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

1 0 1 1 - [5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - 4 - オキソ - 4、5 - ジヒドロ - チアゾル - 2 - イル] - 3 - (2 - トリフルオロメチル - フェニル) - 尿素

1 0 2 2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - ナフタレン - 1 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン

1 0 3 2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - (6 - メトキシ - ナフタレン - 2 - イルメチレン) - チアゾル - 4 - オン

1 0 4 2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - (4 - t - プチル - ベンジ

リデン) - チアゾル - 4 - オン

105 1 - [4 - オキソ - 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - 4、5 - ジヒドロ - チアゾル - 2 - イル] - 3 - (2 - トリフルオロメチル - フェニル) - 尿素

106 1 - [4 - オキソ - 5 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - 4、5 - ジヒドロ - チアゾル - 2 - イル] - 3 - (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 尿素

107 1 - [5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - 4 - オキソ - 4、5 - ジヒドロ - チアゾル - 2 - イル] - 3 - (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 尿素

108 5 - {3 - [4 - (6 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - カルボニル] - ベンジリデン} - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

109 2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - (4 - トリフルオロメトキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

110 5 - {3 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - ピペラジン - 1 - カルボニル] - ベンジリデン} - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

111 N - [3 - (3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イルアミノ) - プロピル] - 3 - (4 - オキソ - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - 4H - チアゾル - 5 - イリデンメチル) - ベンズアミド

112 3 - (4 - オキソ - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - 4H - チアゾル - 5 - イリデンメチル) - 安息香酸 - N' - (2 - クロロ - 4 - トリフルオロメチル - フェニル) - ヒドラジド

113 5 - {3 - [4 - (3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - カルボニル] - ベンジリデン} - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

114 3 - (4 - オキソ - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - 4H - チアゾル - 5 - イリデンメチル) - 安息香酸 - N' - (3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イル) - ヒドラジド

115 5 - {3 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - カルボニル] - ベンジリデン} - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン

116 3 - (4 - オキソ - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - 4H - チアゾル - 5 - イリデンメチル) - 安息香酸 - N' - (2 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - フェニル) - ヒドラジド

117 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

118 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

119 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - トリフルオロメトキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

120 5 - (4 - t - ブチル - ベンジリデン) - 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン

121 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン

122 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - アリリデン] - 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン

123 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - ナフタレン - 1 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン

124 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (3 - フェノキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

1 2 5 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - フエノキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 2 6 5 - (3 - ベンジルオキシ - ベンジリデン) - 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
1 2 7 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 2 8 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - フラン - 2 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
1 2 9 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - ナフタレン - 2 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
1 3 0 3 - [2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 4 - オキソ - 4 H - チアゾル - 5 - イリデンメチル] - 安息香酸
1 3 1 5 - ナフタレン - 1 - イルメチレン - 2 - ピペラジン - 1 - イル - チアゾル - 4 - オン
1 3 2 2 - ピペラジン - 1 - イル - 5 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 3 3 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - チアゾル - 4 - オン
1 3 4 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - ベンジリデン) - 2 - ピペラジン - 1 - イル - チアゾル - 4 - オン
1 3 5 5 - (4 - イソプロピル - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
1 3 6 5 - (4 - イソプロピル - ベンジリデン) - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
1 3 7 2 - [4 - (2 - フルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - イソプロピル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 3 8 5 - (4 - ペンタフルオロスルファニル) - ベンジリデン) - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
1 3 9 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - イソプロピル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - (4 - ブチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - (4 - ペンチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - (4 - オクチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 4 3 2 - [4 - (6 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 4 4 5 - (4 - t - ブチル - ベンジリデン) - 2 - [4 - (6 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
1 4 5 2 - [4 - (6 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 4 6 2 - [4 - (6 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 4 7 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - アリリデン] - 2 - [4 - (6 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
1 4 8 2 - [4 - (6 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 4 9 2 - [4 - (6 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5

- (4 - イソプロピル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 5 0 2 - [4 - (6 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5
- (4 - トリフルオロメトキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 5 1 2 - [4 - (6 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5
- ナフタレン - 2 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
1 5 2 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - 2 - [4 - (6 - メチル - ピリダジン - 3
- イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
1 5 3 5 - (4 - イソプロピル - ベンジリデン) - 2 - [4 - (6 - メチル - ピリダジ
ン - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
1 5 4 5 - (4 - t - プチル - ベンジリデン) - 2 - [4 - (6 - メチル - ピリダジ
ン - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
1 5 5 5 - [3 - (4 - t - プチル - フェニル) - アリリデン] - 2 - [4 - (6 - メ
チル - ピリダジン - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
1 5 6 2 - [4 - (6 - メチル - ピリダジン - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] -
5 - (4 - トリフルオロメトキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 5 7 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - ベンジリデン) - 2 - [4 - (6 - メチ
ル - ピリダジン - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
1 5 8 2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - (4 - ペンタフルオロスル
ファニル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 5 9 2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - { 3 - [4 - (4 - クロロ
- [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - カルボニル] - ベンジリ
デン } - チアゾル - 4 - オン
1 6 0 2 - [4 - (6 - メチル - ピリダジン - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] -
5 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 6 1 2 - [4 - (6 - メチル - ピリダジン - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] -
5 - (3 - フェニル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 6 2 2 - [4 - (6 - メチル - ピリダジン - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] -
5 - ナフタレン - 2 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
1 6 3 2 - [4 - (6 - メチル - ピリダジン - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] -
5 - ナフタレン - 1 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
1 6 4 2 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - (4 - イソプロピル - ベン
ジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 6 5 3 - { 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピ
ペラジン - 1 - イル] - 4 - オキソ - 4H - チアゾル - 5 - イリデンメチル } - 安息香酸
1 6 6 5 - { 3 - [4 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニル) - 4 - ヒ
ドロキシ - ピペリジン - 1 - カルボニル] - ベンジリデン } - 2 - チオモルホリン - 4 -
イル - チアゾル - 4 - オン
1 6 7 5 - { 3 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピ
ペラジン - 1 - カルボニル] - ベンジリデン } - 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5
] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
1 6 8 5 - { 3 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - カル
ボニル] - ベンジリデン } - 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3
- イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
1 6 9 5 - [3 - (4 - ベンジル - ピペラジン - 1 - カルボニル) - ベンジリデン] -
2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 -
イル] - チアゾル - 4 - オン
1 7 0 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジ
ン - 1 - イル] - 5 - { 3 - [4 - (6 - メトキシ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジ
ン - 1 - カルボニル] - ベンジリデン } - チアゾル - 4 - オン
1 7 1 2 - [4 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニル) - 4 - ヒドロキ

シ - ピペリジン - 1 - イル] - 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 7 2 2 - [4 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニル) - 4 - ヒドロキ
シ - ピペリジン - 1 - イル] - 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - ベンジリデン) -
チアゾル - 4 - オン
1 7 3 2 - [4 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニル) - 4 - ヒドロキ
シ - ピペリジン - 1 - イル] - 5 - ナフタレン - 1 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
1 7 4 2 - [4 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェニル) - 4 - ヒドロキ
シ - ピペリジン - 1 - イル] - 5 - (3 - メトキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オ
ン
1 7 5 5 - ベンジリデン - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
1 7 6 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4
- オン
1 7 7 2 - ジエチルアミノ - 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
1 7 8 5 - (4 - クロロ - ベンジリデン) - 2 - ジエチルアミノ - チアゾル - 4 - オン
1 8 0 5 - ベンジリデン - 2 - ジエチルアミノ - チアゾル - 4 - オン
1 8 1 5 - (4 - クロロ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4
- オン
1 8 2 5 - (4 - クロロ - ベンジリデン) - 2 - ピペリジン - 1 - イル - チアゾル - 4
- オン
1 8 3 5 - (4 - クロロ - ベンジリデン) - 2 - ピロリジン - 1 - イル - チアゾル - 4
- オン
1 8 4 5 - ベンジリデン - 2 - ピロリジン - 1 - イル - チアゾル - 4 - オン
1 8 6 5 - ビフェニル - 4 - イルメチレン - 2 - ピペリジン - 1 - イル - チアゾル - 4
- オン
1 8 7 2 - アゼパン - 1 - イル - 5 - ビフェニル - 4 - イルメチレン - チアゾル - 4 -
オン
1 8 8 5 - ビフェニル - 4 - イルメチレン - 2 - ピロリジン - 1 - イル - チアゾル - 4
- オン
1 8 9 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - チアゾル - 4
- オン
1 9 0 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル
- 4 - オン
1 9 1 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - 2 - ピペリジン - 1 - イル - チアゾル - 4
- オン
1 9 2 2 - アゼパン - 1 - イル - 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - チアゾル - 4 -
オン
1 9 3 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - 2 - ピロリジン - 1 - イル - チアゾル - 4
- オン
1 9 4 5 - ビフェニル - 4 - イルメチレン - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4
- オン
1 9 5 2 - チオモルホリン - 4 - イル - 5 - (3 - トリフルオロメチル - ベンジリデン
) - チアゾル - 4 - オン
1 9 6 5 - (4 - クロロ - ベンジリデン) - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル
- 4 - オン
1 9 7 5 - (4 - t - ブチル - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル
- 4 - オン
1 9 8 5 - (4 - t - ブチル - ベンジリデン) - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チア
ゾル - 4 - オン
1 9 9 5 - (4 - t - ブチル - ベンジリデン) - 2 - ピロリジン - 1 - イル - チアゾル
- 4 - オン

200 2 - アゼパン - 1 - イル - 5 - (4 - t - プチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
201 5 - (4 - t - プチル - ベンジリデン) - 2 - ピペリジン - 1 - イル - チアゾル - 4 - オン
202 2 - チオモルホリン - 4 - イル - 5 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
203 5 - (4 - t - プチル - ベンジリデン) - 2 - ジエチルアミノ - チアゾル - 4 - オン
204 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
205 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (3 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
207 5 - ビフェニル - 4 - イルメチレン - 2 - ジエチルアミノ - チアゾル - 4 - オン
208 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - チオフェン - 2 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
209 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - ナフタレン - 1 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
210 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - ピリジン - 2 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
211 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
212 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - ピリジン - 3 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
213 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - ピリジン - 4 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
214 2 - ジエチルアミノ - 5 - (3 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
215 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - 2 - ピロリジン - 1 - イル - チアゾル - 4 - オン
216 5 - (4 - t - プチル - ベンジリデン) - 2 - (2 - メトキシ - エチルアミノ) - チアゾル - 4 - オン
217 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (4 - オクチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
219 5 - (3、4 - ジメトキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
220 5 - (2 - ヒドロキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
221 5 - (2 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
222 5 - (4 - t - プチル - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
223 5 - (4 - ジエチルアミノ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
224 5 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
225 4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - 4 - オキソ - 4 H - チアゾル - 5 - イリデンメチル) - 安息香酸
226 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (2、3、4 - トリメトキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
227 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (3、4、5 - トリメトキシ - ベンジリデン)

- チアゾル - 4 - オン
2 2 8 5 - (4 - メトキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
2 2 9 5 - (4 - ヒドロキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
2 3 0 5 - (3 - エトキシ - 4 - ヒドロキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
2 3 1 5 - (3 - ヒドロキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
2 3 2 5 - (4 - プロモ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
2 3 3 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (4 - ビニルオキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
2 3 4 ベンゼンスルホン酸 - 4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - 4 - オキソ - 4 H - チアゾル - 5 - イリデンメチル) - フェニルエステル
2 3 5 5 - (4 - ジメチルアミノ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
2 3 6 4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - 4 - オキソ - 4 H - チアゾル - 5 - イリデンメチル) - 安息香酸メチルエステル
2 3 7 5 - (3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
2 3 8 5 - [4 - (3、3 - ジメチル - ブトキシ) - 3 - メトキシ - ベンジリデン] - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
2 3 9 5 - (2 - メトキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
2 4 0 5 - (4 - ヒドロキシ - ベンジリデン) - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
2 4 1 2 - [(ベンゾ [1、3] ジオキソル - 5 - イルメチル) - アミノ] - 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - アリリデン] - チアゾル - 4 - オン
2 4 2 2 - [(ベンゾ [1、3] ジオキソル - 5 - イルメチル) - アミノ] - 5 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
2 4 3 2 - [(ベンゾ [1、3] ジオキソル - 5 - イルメチル) - アミノ] - 5 - (4 - トリフルオロメトキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
2 4 4 2 - [(ベンゾ [1、3] ジオキソル - 5 - イルメチル) - アミノ] - 5 - ナフタレン - 1 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
2 4 5 2 - [(ベンゾ [1、3] ジオキソル - 5 - イルメチル) - アミノ] - 5 - (2 - クロロ - 3 - フェニル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン
2 4 6 2 - (4 - メチル - ベンジルアミノ) - 5 - ナフタレン - 1 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
2 4 7 2 - (4 - メチル - ベンジルアミノ) - 5 - (3 - フェノキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
2 4 8 2 - (4 - メチル - ベンジルアミノ) - 5 - (4 - フェノキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
2 4 9 5 - (2 - クロロ - 3 - フェニル - アリリデン) - 2 - (4 - メチル - ベンジルアミノ) - チアゾル - 4 - オン
2 5 0 2 - (4 - メチル - ベンジルアミノ) - 5 - ナフタレン - 2 - イルメチレン - チアゾル - 4 - オン
2 5 1 2 - (3 - メトキシ - ベンジルアミノ) - 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン
2 5 2 5 - (4 - t - ブチル - ベンジリデン) - 2 - (3 - メトキシ - ベンジルアミノ

) - チアゾル - 4 - オン

253 2 - (3 - メトキシ - ベンジルアミノ) - 5 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

254 2 - (3 - メトキシ - ベンジルアミノ) - 5 - (4 - トリフルオロメトキシ - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン

255 2 - (3 - メトキシ - ベンジルアミノ) - 5 - (3 - フェニル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン

256 5 - ナフタレン - 1 - イルメチレン - 2 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジルアミノ) - チアゾル - 4 - オン

257 5 - (3 - フェノキシ - ベンジリデン) - 2 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジルアミノ) - チアゾル - 4 - オン

258 5 - (4 - フェノキシ - ベンジリデン) - 2 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジルアミノ) - チアゾル - 4 - オン

259 5 - (2 - クロロ - 3 - フェニル - アリリデン) - 2 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジルアミノ) - チアゾル - 4 - オン

260 5 - (3 - ベンジルオキシ - ベンジリデン) - 2 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジルアミノ) - チアゾル - 4 - オン

261 5 - ナフタレン - 2 - イルメチレン - 2 - (4 - トリフルオロメチル - ベンジルアミノ) - チアゾル - 4 - オン

262 2 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル) - 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オン及び

263 2 - (4 - t - ブチル - フェニル - アミノ) - 5 - (4 - メチル - ベンジリデン) - チアゾル - 4 - オンより成る群から選ばれた、

それぞれ場合により、その純粋な立体異性体のうちの1つ、殊に鏡像異性体又はジアステレオマー、そのラセミ化合物の形か、任意の混合比での、立体異性体、殊に鏡像異性体及び(又は)ジアステレオマー、の混合物の形か、それぞれ相応の塩の形か、あるいはそれ相応の溶媒和化合物の形である

ことを特徴とする、請求項1～14のいずれか1つに記載の化合物の使用。

【誤訳訂正4】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】請求項18

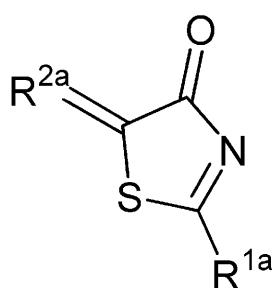
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【請求項18】

それぞれ場合により、その純粋な立体異性体のうちの1つ、殊に鏡像異性体又はジアステレオマー、そのラセミ化合物の形か、任意の混合比での、立体異性体、殊に鏡像異性体及び(又は)ジアステレオマー、の混合物の形か、それぞれ相応の塩の形か、あるいはそれ相応の溶媒和化合物の形である、一般式Ia

【化9】



Ia

{式中、

R^{1a}は置換されていないか又は少なくとも1回置換された単環状又は多環状環系と縮合

していてよい、置換されていないか又は少なくとも1回置換された不飽和又は飽和の、場合により少なくとも1つのヘテロ原子を環メンバーとして有する環状脂肪族基を示すか；
NR^{3 a}R^{4 a}基を示すか；

NR^{5 a}-C(=O)-R^{6 a}基を示すか

あるいはNR^{7 a}-C(=O)-NR^{8 a}R^{9 a}基を示し；

R^{2 a}はCH-CH=C(CH₃)-W^a-Z^a、CH-CH=CH-W^a-Z^a、CH-C(CH₃)=CH-W^a-Z^a、CH-C(フェニル)=CH-W^a-Z^a、CH-CBr=CH-W^a-Z^a、CH-CCl=CH-W^a-Z^a、CH-CF=CH-W^a-Z^a、CH-C(OH)=CH-W^a-Z^a、CH-CH₂-CH₂-W^a-Z^a、CH-CH₂-CH(CH₃)-W^a-Z^a又はCH-CH(CH₃)-CH₂-W^a-Z^aを示し；

この際、W^aはそれぞれ存在していなくともよいか又はそれぞれ相互に無関係に、O、S、N(H)、N(CH₃)、N(C₂H₅)及びN[CH(CH₃)₂]より成る群から選ばれた基を示し；

R^{3 a}は線状又は分枝状の、飽和又は不飽和の、置換されていないか又は少なくとも1回置換された、場合により少なくとも1つのヘテロ原子を環メンバーとして有する脂肪族基を示すか；

置換されていないか又は少なくとも1回置換された単環状又は多環状環系と縮合していくよい、置換されていないか又は少なくとも1回置換された、不飽和又は飽和の、場合により少なくとも1つのヘテロ原子を環メンバーとして有する環状脂肪族基を示すか；

あるいは置換されていないか又は少なくとも1回置換された単環状又は多環状環系と縮合していくよいか、及び(又は)線状又は分枝状の、置換されていないか又は少なくとも1回置換されたアルキレン基、アルケニレン基又はアルキニレン基を介して結合していくよい置換されていないか又は少なくとも1回置換されたアリール基又はヘテロアリール基を示し；

R^{4 a}は水素基を示すか；線状又は分枝状の、飽和又は不飽和の、置換されていないか又は少なくとも1回置換された、場合により少なくとも1つのヘテロ原子を環メンバーとして有する脂肪族基を示し；R^{5 a}、R^{7 a}及びR^{9 a}は相互に無関係にそれぞれ水素基を示すか；水素基を示すか；あるいは線状又は分枝状の、飽和又は不飽和の、置換されていないか又は少なくとも1回置換された脂肪族基を示し；R^{6 a}及びR^{8 a}は相互に無関係にそれぞれ、置換されていないか又は少なくとも1回置換された単環状又は多環状環系と縮合していくよい、置換されていないか又は少なくとも1回置換されたアリール基又はヘテロアリール基を示し；Z^aは線状又は分枝状の、飽和又は不飽和の、置換されていないか又は少なくとも1回置換された脂肪族基を示すか；置換されていないか又は少なくとも1回置換された单環状又は多環状環系と縮合していくよいか、及び(又は)同一か又は異なる置換基R^{1 2 a}で置換されているアリール基を示し；あるいは置換されていないか又は少なくとも1回置換された单環状又は多環状環系と縮合していくよいか、及び(又は)同一か又は異なる置換基R^{1 2 a}で置換されていてよいヘテロアリール基を示し；

R^{1 2 a}は、F、Cl、Br、I、-CN、-CF₃、-SF₅、-OH、-O-C₁₋₁₀-アルキル、-O-C₂₋₁₀-アルケニル、-NH₂、-O-CF₃、-S-CF₃、-SH、-S-C₁₋₅-アルキル、-C₁₋₁₀-アルキル、-C(=O)-OH、-C(=O)-O-C₁₋₅-アルキル、-O-C(=O)-C₁₋₅-アルキル、-NH-C₁₋₅-アルキル、-N(C₁₋₅-アルキル)₂、-NH-C(=O)-O-C₁₋₅-アルキル、-C(=O)-H、-C(=O)-C₁₋₅-アルキル、-C(=O)-NH₂、-C(=O)-NH-C₁₋₅-アルキル、-C(=O)-N-(C₁₋₅-アルキル)₂、-S(=O)₂-C₁₋₅-アルキル、-S(=O)₂-フェニル、-O-S(=O)₂-フェニル、-NH-S(=O)₂-C₁₋₅-アルキル、-S(=O)₂-NH-C₁₋₅-アルキル、シクロヘキシリ、シクロペンチル、ピリジニル、ピリダジニル、-(CH₂)-ベンゾ[b]フラニル、-O-フェニル、-O-ベンジル、フェニル及びベンジルより成る群から選ばれた基(上記ピリジニル、シクロペンチル、シ

クロヘキシル、ピリダジニル、-S(=O)₂-フェニル、-O-S(=O)₂-フェニル、-O-フェニル、-O-ベンジル、フェニル、-(CH₂)-ベンゾ[b]フラニル及びベンジル基の環状部分のそれぞれは置換されていてよい。)を示すか；

-C(=O)-NR^{1~3a}-(CH₂)_m-NR^{1~4a}-R^{1~5a}基、この際m aは0、1、2、3、4又は5である、を示すか；

あるいはC(=O)-R^{1~6a}基を示し；

R^{1~3a}及びR^{1~4a}は相互に無関係にそれぞれ、

水素基を示すか；

あるいは線状又は分枝状の、飽和又は不飽和の、置換されていないか又は少なくとも1回置換された脂肪族基を示し；

R^{1~5a}は置換されていないか又は少なくとも1回置換された単環状又は多環状環系と縮合してよい、置換されていないか又は少なくとも1回置換されたアリール基又はヘテロアリール基を示し；

そして

R^{1~6a}は置換されていないか又は少なくとも1回置換された単環状又は多環状環系と縮合してよい、置換されていないか又は少なくとも1回置換された不飽和又は飽和の、場合により少なくとも1つのヘテロ原子を環メンバーとして有する環状脂肪族基を示す。

}

で表わされる2、5-ジ置換されたチアゾール-4-オン誘導体。

【誤訳訂正5】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】請求項29

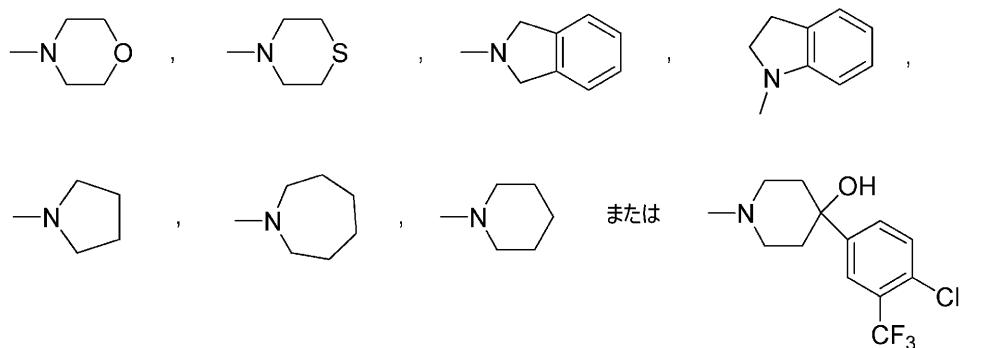
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【請求項29】

R^{1a}が次の基

【化12】



のうちの1つを示すか

次の基

【化13】



(式中、-NH基の水素原子がメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、s-ブチル、イソブチル、t-ブチル、ピリジニル、ピリダジニル、[1、2、5]-チアジアゾリル、ベンジル及びフェニルより成る群から選ばれた置換基で置換されていてよく、この際ピリジニル、ピリダジニル、[1、2、5]-チアジアゾリル、ベンジル及びフェニル基の環状部分のそれぞれはF、Cl、Br、-CF₃、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、s-ブチル、イソブチル、t-ブチル、-O-CH₃、-O-C₂H₅、-O-CF₃及び-S-CF₃から成る群より相互に無関係に

選択された 1、2 又は 3 個の置換基で置換されていてよい。)

を示すか ;

$\text{NR}^3 \text{a} \text{R}^4 \text{a}$ 基を示すか

あるいは $\text{NR}^7 \text{a} - \text{C} (= \text{O}) - \text{NR}^8 \text{a} \text{R}^9 \text{a}$ 基を示し ;

$\text{R}^2 \text{a}$ が $\text{CH} - \text{CH} = \text{C} (\text{CH}_3) - \text{Z} \text{a}$ 、 $\text{CH} - \text{CH} = \text{CH} - \text{Z} \text{a}$ 、 $\text{CH} - \text{CH} = \text{CH} - \text{S} - \text{Z} \text{a}$ 、 $\text{CH} - \text{C} (\text{CH}_3) = \text{CH} - \text{Z} \text{a}$ 、 $\text{CH} - \text{C}$ (フェニル) = $\text{CH} - \text{Z} \text{a}$ 、 $\text{CH} - \text{CBr} = \text{CH} - \text{Z} \text{a}$ 、 $\text{CH} - \text{Cl} = \text{CH} - \text{Z} \text{a}$ 、 $\text{CH} - \text{CF} = \text{CH} - \text{Z} \text{a}$ 、 $\text{CH} - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{Z} \text{a}$ 、 $\text{CH} - \text{CH}_2 - \text{CH} (\text{CH}_3) - \text{Z} \text{a}$ 又は $\text{CH} - \text{CH} (\text{CH}_3) - \text{CH}_2 - \text{Z} \text{a}$ を示し ;

$\text{R}^3 \text{a}$ がメチル、 $-\text{CH}_2 - \text{O} - \text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2 - \text{S} - \text{CH}_3$ 、 エチル、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{S} - \text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{O} - \text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{N} (\text{CH}_3) - \text{CH}_3$ 、 n - プロピル、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{S} - \text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{O} - \text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{CH}_2 - \text{N} (\text{CH}_3) - \text{CH}_3$ 、 イソプロピル、 n - ブチル、 s - ブチル、 イソブチル、 t - ブチル、 (1、1) - ジメチル - プロピル、 n - ペンチル、 s - ペンチル、 n - ヘキシル及び n - ヘプチルより成る群から選ばれた基を示し ;

あるいは フェニル、 ナフチル、 ベンジル、 (1、3) - ベンゾジオキソリル及び (1、4) - ベンゾジオキサニルより成る群から選ばれた基 (これらの基は F、 Cl、 Br、 - CF₃ 、 - O - CF₃ 、 - OCH₃ 、 - OC₂H₅ 、 メチル、 エチル、 n - プロピル、 イソプロピル、 n - ブチル及び t - ブチルから成る群より相互に無関係に選択された 1、2、 3、 4 又は 5 個の置換基でされていてよい、 を示し ;

$\text{R}^4 \text{a}$ が水素基を示すか

あるいは メチル、 エチル、 n - プロピル、 イソプロピル、 n - ブチル、 s - ブチル、 イソブチル、 t - ブチル、 (1、1) - ジメチル - プロピル、 n - ペンチル、 s - ペンチル、 n - ヘキシル及び n - ヘプチルより成る群から選ばれた基を示し ;

$\text{R}^7 \text{a}$ 及び $\text{R}^8 \text{a}$ がそれぞれ水素基を示し ;

$\text{R}^9 \text{a}$ が、 F、 Cl、 Br 及び - CF₃ から成る群より相互に無関係に選択された 1、 2、 3、 4 又は 5 個の置換基で置換されていてよいフェニル基を示し ;

$\text{Z} \text{a}$ がメチル、 エチル、 n - プロピル、 イソプロピル、 n - ブチル、 s - ブチル、 イソブチル、 t - ブチル、 (1、1) - ジメチル - プロピル、 n - ペンチル、 s - ペンチル、 n - ヘキシル、 n - ヘプチル及び n - オクチルより成る群から選ばれた基を示し ;

あるいは フェニル基又はナフチル基 (これらの基は 1、 2、 3、 4 又は 5 個の同一か又は異なる置換基 R^{1~2 a} で置換されている。) を示し ;

R^{1~2 a} が F、 Cl、 Br、 I、 - CN、 - CF₃ 、 - SF₅ 、 - OH 、 - O - CH₃ 、 - O - C₂H₅ 、 - O - CH₂ - CH₂ - CH₃ 、 - O - CH₂ - (CH₃)₃ 、 - O - CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₃ 、 - O - CH₂ - CH₂ - C(CH₃)₃ 、 - O - CH = CH₂ 、 - O - CH₂ - CH = CH₂ 、 - NH₂ 、 - O - CF₃ 、 - S - CF₃ 、 - SH 、 - S - CH₃ 、 - S - C₂H₅ 、 - S - CH₂ - CH₂ - CH₃ 、 - S - CH₂ - CH₂ - CH₂ - CH₃ 、 - S - C(CH₃)₃ 、 メチル、 エチル、 n - プロピル、 イソプロピル、 n - ブチル、 s - ブチル、 t - ブチル、 n - ペンチル、 n - ヘキシル、 n - ヘプチル及び n - オクチルより成る群から選ばれた基を示す、

それぞれ場合により、 その純粋な立体異性体のうちの 1 つ、 殊に鏡像異性体又はジアステレオマー、 そのラセミ化合物の形か、 任意の混合比での、 立体異性体、 殊に鏡像異性体及び(又は)ジアステレオマー、 の混合物の形か、 それぞれ相応の塩の形か、 あるいはそれぞれ相応の溶媒和化合物の形である、 請求項 18 ~ 28 のいずれか 1 つに記載の化合物。

【誤訳訂正 6】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】請求項 3 0

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【請求項 3 0】

1 . 5 - [3 - (4 - メトキシ - フェニル) - プト - 2 - エニリデン] - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
 2 . 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - アリリデン] - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
 3 . 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (3 - m - トリル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン
 4 . 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (3 - p - トリル - アリリデン) - チアゾル - 4 - オン
 5 . 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - オクチリデン - チアゾル - 4 - オン
 6 . 5 - ブチリデン - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
 7 . 5 - ヘキシリデン - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
 8 . 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - (3 - p - トリル - プト - 2 - エニリデン) - チアゾル - 4 - オン
 9 . 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - プト - 2 - エニリデン] - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
 10 . 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - アリリデン] - 2 - [4 - (3 - メトキシ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
 11 . 5 - [3 - (4 - ヒドロキシ - 3 - メトキシ - フェニル) - アリリデン] - 2 - チオモルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
 12 . 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - [3 - (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - プト - 2 - エニリデン] - チアゾル - 4 - オン
 13 . 2 - モルホリン - 4 - イル - 5 - [3 - (3 - トリフルオロメチル - フェニル) - プト - 2 - エニリデン] - チアゾル - 4 - オン
 14 . 5 - デシリデン - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
 15 . 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - アリリデン] - 2 - モルホリン - 4 - イル - チアゾル - 4 - オン
 16 . 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - アリリデン] - 2 - [4 - (3 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
 17 . 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - アリリデン] - 2 - [4 - (2 - フルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
 18 . 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - アリリデン] - 2 - [4 - (4 - クロロ - [1、2、5] チアジアゾル - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
 19 . 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - アリリデン] - 2 - [4 - (6 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
 20 . 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - アリリデン] - 2 - [4 - (6 - メチル - ピリダジン - 3 - イル) - ピペラジン - 1 - イル] - チアゾル - 4 - オン
 21 . 2 - [(ベンゾ [1、3] ジオキソル - 5 - イルメチル) - アミノ] - 5 - [3 - (4 - t - ブチル - フェニル) - アリリデン] - チアゾル - 4 - オン

より成る群から選ばれた、

それぞれ場合により、その純粋な立体異性体のうちの1つ、殊に鏡像異性体又はジアステレオマー、そのラセミ化合物の形か、任意の混合比での、立体異性体、殊に鏡像異性体及び(又は)ジアステレオマー、の混合物の形か、それ相応の塩の形か、あるいはそれ相応の溶媒和化合物の形である、請求項 18 ~ 29 のいずれか1つに記載の化合物。

【誤訳訂正 7】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】請求項 3 1

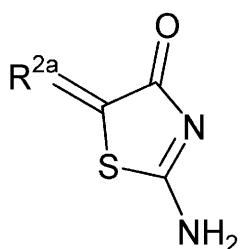
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【請求項 3 1】

2 - アミノ - チアゾル - 4 - オンを酢酸中で酢酸ナトリウム及び酢酸カリウムより成る群から選ばれた少なくとも 1 つの塩の存在下にか又はメタノール、エタノール、イソブロパノール及び *n* - ブタノールより成る群から選ばれた反応媒体中でトリエチルアミン、ピリジン、ジイソプロピルアミン及び N - メチルモルホリンより成る群から選ばれた少なくとも 1 つの有機塩基の存在下に一般式 R - C (= O) - H (式中、R は - C H = C (C H₃) - W^a - Z^a 、 - C H = C H - W^a - Z^a 、 - C (C H₃) = C H - W^a - Z^a 、 - C (フェニル) = C H - W^a - Z^a 、 - C B r = C H - W^a - Z^a 、 - C C l = C H - W^a - Z^a 、 - C F = C H - W^a - Z^a 、 - C (O H) = C H - W^a - Z^a 、 - C H₂ - C H₂ - W^a - Z^a 、 - C H₂ - C H (C H₃) - W^a - Z^a 又は - C H (C H₃) - C H₂ - W^a - Z^a を示し、そして W^a 及び Z^a は請求項 18 ~ 30 のいずれか 1 つに記載の意味を有する。) で表わされる、少なくとも 1 種の化合物と反応させ、一般式 IIa

【化 1 4】



IIa

(式中、R^{2a} は請求項 18 ~ 30 のいずれか 1 つに記載の意味を有する。)

で表わされる、少なくとも 1 種の化合物とし、ついで場合によりこれを精製するか及び(又は)単離し、

さらに一般式 IIa の少なくとも 1 種の化合物を反応媒体中で少なくとも 1 つの塩基の存在下に、好ましくは少なくとも 1 つの金属水素化物塩又は金属アルコラート塩の存在下に、特に好ましくは水素化ナトリウム、水素化カリウム、カリウム - t - ブタノラート、ナトリウム - t - ブタノラート、カリウムメタノラート、ナトリウムメタノラート、ナトリウムエタノラート及びカリウムエタノラートより成る群から選ばれた 1 つの金属水素化物塩又は金属アルコラート塩の存在下に一般式 L G - R^{3a} 又は一般式 L G - R^{7a} 又は一般式 L G - R^{5a} (式中、L G はそれぞれ、離脱基、好ましくはハロゲン原子、塩素原子を示し、そして R^{3a} 、 R^{5a} 及び R^{7a} はそれぞれ請求項 18 ~ 30 のいずれか 1 つに記載の意味を有する。) で表わされる、少なくとも 1 種の化合物と反応させて、一般式 Ia (式中、R^{2a} は上記意味を有し、そして R^{1a} は N H R^{3a} - 、 N H R^{5a} - 又は N H R^{7a} 基を示す。) で表わされる、少なくとも 1 種の化合物とし、ついで場合によりこれを精製するか及び(又は)単離し、

さらに場合により一般式 IIa (式中、R^{2a} は上記意味を有し、そして R^{1a} は N H R^{7a} 基を示す。) で表わされる、少なくとも 1 種の化合物を反応媒体中で一般式 R^{8a} - N = C = O (式中、R^{8a} は請求項 18 ~ 30 のいずれか 1 つに記載の意味を有する。) で表わされる、少なくとも 1 つのイソシアナートと反応させて、場合により少なくとも 1 つの塩基の存在下に、好ましくは、トリエチルアミン、4、4 - ジメチルアミノピリジン及びジイソプロピルエチルアミンより成る群から選ばれた少なくとも 1 つの塩基の存在下に一般式 Ia (式中、R^{2a} は上記意味を有し、そして R^{1a} は N R^{7a} - C (= O) - N H R^{8a} 基を示す、) で表わされる、少なくとも 1 種の化合物とし、ついで場合によりこれを精製するか及び(又は)単離し；

さらに場合により一般式 Ia (式中、R^{2a} は上記意味を有し、そして R^{1a} は N R^{7a} - C (= O) - N H R^{8a} 基を示す。) で表わされる、少なくとも 1 種の化合物を反応媒体中で少なくとも 1 つの塩基の存在下に、好ましくは少なくとも 1 つの金属水素化物塩又は金属アルコラート塩の存在下に、特に好ましくは水素化ナトリウム、水素化カリウム、

カリウム - t - ブタノラート、ナトリウム - t - ブタノラート、カリウムメタノラート、ナトリウムメタノラート、ナトリウムエタノラート及びカリウムエタノラートより成る群から選ばれた1つの金属水素化物塩又は金属アルコラート塩の存在下に一般式 $L G - R^9$ ^a (式中、 $L G$ は離脱基、好ましくはハロゲン原子、塩素原子を示し、そして R^9 ^a は請求項18～30のいずれか1つに記載の意味を有する。) で表わされる、少なくとも1種の化合物と反応させて一般式 I a (式中、 R^2 ^a は上記意味を有し、そして R^1 ^a は $N R^7$ ^a - C (=O) - N R⁸^a R⁹^a 基を示す。) で表わされる、少なくとも1種の化合物とし、ついで場合によりこれを精製するか及び(又は)単離するか、あるいは

場合により一般式 II a (式中、 R^2 ^a は上記意味を有し、そして R^1 ^a は $N H R^5$ ^a 基を示す。) で表わされる、少なくとも1種の化合物を反応媒体中で場合により少なくとも1つの塩基の存在下に一般式 R^6 ^a - C (=O) - L G R⁶^a (式中、 R^6 ^a は請求項18～30のいずれか1つに記載の意味を有しそして $L G$ は離脱基、好ましくはハロゲン基を示す。) で表わされる、少なくとも1種の化合物と反応させてか、又は反応媒体中で少なくとも1つのそしてプリング試薬の存在下に場合により少なくとも1つの塩基の存在下に一般式 R^6 ^a - C (=O) - OH、式中 R^6 ^a は請求項18～30のいずれか1つに記載の意味を有する。) で表わされる、少なくとも1種の化合物と反応させて一般式 I a (式中、 R^2 ^a は上記意味を有し、そして R^1 ^a は $N R^5$ ^a - C (=O) - R⁶^a 基を示す。) で表わされる、少なくとも1種の化合物とし、ついで場合によりこれを精製するか及び(又は)単離するか、あるいは

場合により一般式 I a (式中、 R^2 ^a は上記意味を有し、そして R^1 ^a は $N H R^3$ ^a 基を示す。) で表わされる、少なくとも1種の化合物を反応媒体中で少なくとも1つの塩基の存在下に、好ましくは少なくとも1つの金属水素化物塩又は金属アルコラート塩の存在下に、特に好ましくは水素化ナトリウム、水素化カリウム、カリウム - t - ブタノラート、ナトリウム - t - ブタノラート、カリウムメタノラート、ナトリウムメタノラート、ナトリウムエタノラート及びカリウムエタノラートより成る群から選ばれた1つの金属水素化物塩又は金属アルコラート塩の存在下に一般式 $L G - R^4$ ^a (式中、 $L G$ は離脱基、好ましくはハロゲン原子、塩素原子を示し、そして R^4 ^a は請求項18～30のいずれか1つに記載の意味を有する。) で表わされる、少なくとも1種の化合物と反応させて一般式 I a (式中、 R^2 ^a は上記意味を有し、そして R^1 ^a は $N R^3$ ^a R⁴^a 基を示す。) で表わされる、少なくとも1種の化合物とし、ついで場合によりこれを精製するか及び(又は)単離する、請求項18～30のいずれか1つに記載の一般式 I a の2、5 - ジ置換されたチアゾル - 4 - オン誘導体の製造方法。