

【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24年8月30日(2012.8.30)

【公表番号】特表2011-528007(P2011-528007A)

【公表日】平成23年11月10日(2011.11.10)

【年通号数】公開・登録公報2011-045

【出願番号】特願2011-517863(P2011-517863)

【国際特許分類】

C 07 D 239/54	(2006.01)
C 07 D 251/46	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
A 61 K 31/53	(2006.01)
C 07 D 401/04	(2006.01)
C 07 D 409/14	(2006.01)
A 61 P 3/04	(2006.01)
A 61 P 3/06	(2006.01)
A 61 P 3/00	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 1/16	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 17/10	(2006.01)
A 61 P 17/08	(2006.01)

【F I】

C 07 D 239/54	C S P B
C 07 D 251/46	A
A 61 K 31/506	
A 61 K 31/53	
C 07 D 401/04	
C 07 D 409/14	
A 61 P 3/04	
A 61 P 3/06	
A 61 P 3/00	
A 61 P 9/10	1 0 1
A 61 P 9/00	
A 61 P 1/16	
A 61 P 17/06	
A 61 P 17/10	
A 61 P 17/08	

【手続補正書】

【提出日】平成24年7月9日(2012.7.9)

【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】

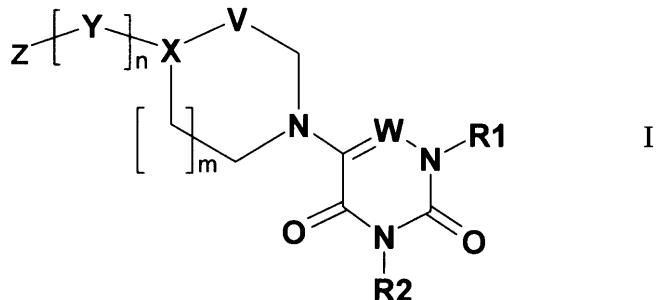
【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式 I に対応する S C D - 1 酵素活性阻害薬として使用するための 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオンおよび H - ピリミジン - 2 , 4 - ジオンの誘導体、並びに

薬学上許容可能な塩基および酸との付加塩、および不斉炭素を有する化合物の様々な鏡像異性体、並びに特にラセミ混合物を包含する任意の比率でのそれらの混合物：

【化 1】



(上記式中、

W は、窒素または C H を表し、

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は、互いに独立して

水素または直鎖状もしくは分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>7</sub> アルキルもしくはアルケニル基、または

トリフルオロメチル、ニトリル、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルコキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシアルコキシ、インドリル、チオフェニル、オキソチオフェニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> N - アルキルまたは N - ジアルキルカルバモイル基、または

フェニル、アロイル、ベンジルオキシまたは N - アリールカルバモイル基（これについて、フェニル環は場合によっては直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、ニトロ基、ハロゲン原子のような 1 個以上の基で置換されている）

のような基で置換された C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル基、

場合によってはハロゲン原子、ニトロ、ニトリル、トリフルオロメチル、ビニル、メチルスルファニル、直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルコキシ、フェニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> N - モノ - またはジ - アルキルカルバモイル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルカルボキサミド基のような 1 個以上の基で置換されたフェニル、ピリジル、ナフチル、またはチオフェニル基、

場合によってはフェニル基と融合した C<sub>5</sub> - C<sub>6</sub> 2 - オキソシクロアルキル基を表し、

m は、0 または 1 であり、

V は、C H<sub>2</sub> 、C H C H<sub>3</sub> または C = O を表し、

n = 1 であるときには、

X - Y は、- N - ( C = O ) - 、- N - C H<sub>2</sub> - 、- C H - C H<sub>2</sub> - 、- C H - O - 、- C H - ( C = O ) - を表し、

Z は、場合によっては 1 個以上のトリフルオロメチル基、ハロゲン原子、直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルコキシ基で置換されたフェニル基を表し、

n = 0 であるときには、

X は N であり、

Z は、フェニル、シンナミル、アリールオキシカルボニルまたは 2 - フェニルアセチル（この基の 2 位は、場合によっては直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルで置換されている）基であって、芳香族基が、場合によっては 1 個以上のトリフルオロメチル基、ハロゲン原子、直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>

<sup>3</sup> アルコキシ、ニトロ基で置換されているものを表す)。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の一般式 I に対応する 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオンおよび H - ピリミジン - 2 , 4 - ジオンの誘導体、並びに

薬学上許容可能な塩基および酸との付加塩、および不斉炭素を有する化合物の様々な鏡像異性体、並びに特にラセミ混合物を包含する任意の比率でのそれらの混合物：

(ここで、式 I 中、

W は、窒素または CH を表し、

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は、

水素(非同時的に)または直鎖状もしくは分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>7</sub> アルキルもしくはアルケニル基、または

トリフルオロメチル、ニトリル、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルコキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシアルコキシ、インドリル、チオフェニル、オキソチオフェニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> N - アルキルまたは N - ジアルキルカルバモイル基、または

フェニル、アロイルベンジルオキシまたは N - アリールカルバモイル基(これについて、フェニル環は直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、ニトロ基、ハロゲン原子のような 1 個以上の基で置換されていることがある)

のような基で置換された C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル基、

ハロゲン原子、ニトロ、ニトリル、トリフルオロメチル、ビニル、メチルスルファニル、直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルコキシ、フェニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> N - モノ - またはジ - アルキルカルバモイル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルカルボキサミド基のような 1 個以上の基で置換されていることがあるフェニルまたはピリジルまたはナフチルまたはチオフェニル基、

場合によってはフェニル基と融合した C<sub>5</sub> - C<sub>6</sub> 2 - オキソシクロアルキル基を表し、

m は、0 または 1 であり、

V は、CH<sub>2</sub>、CHCH<sub>3</sub> または C = O を表し、

n = 1 であるときには、

X - Y は、- N - (C = O) - 、- N - CH<sub>2</sub> - 、- CH - CH<sub>2</sub> - 、- CH - O - 、- CH - (C = O) - を表し、

Z は、化合物 6 - [ 4 - (4 - イソプロピル - ベンジル) - ピペラジン - 1 - ] - 2 , 4 - ジメチル - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオンおよび 2 , 4 - ジメチル - 6 - [ 4 - (3 - トリフルオロ - メチル - ベンジル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオンを除き、1 個以上のトリフルオロメチル基、ハロゲン原子、直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルコキシ基で置換されたフェニル基を表し、

n = 0 であるときには、

X は、N を表し、

Z は、フェニルまたはシンナミルまたはアリールオキシカルボニルまたは 2 - フェニルアセチル基(この基の 2 位は、場合によっては直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルで置換されている)であって、芳香族基が、1 個以上のトリフルオロメチル基、ハロゲン原子、直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、直鎖状または分岐状の C<sub>1</sub> または C<sub>3</sub> アルコキシ、ニトロ基で置換しているものを表し、下記の化合物：

6 - [ 4 - (4 - フルオロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 , 4 - ジメチル - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、

6 - [ 4 - (4 - メトキシ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 , 4 - ジメチル - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、

6 - [ 4 - (2 - クロロ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 , 4 - ジメチル - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン

を除く)。

## 【請求項3】

一般式Iに対応する請求項2に記載の2H-[1,2,4]トリアジン-3,5-ジオンおよびH-ピリミジン-2,4-ジオンの誘導体：

(ここで、式I中、

Wは、窒素またはCHを表し、

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は、

水素(非同時的に)または直鎖状もしくは分岐状のC<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>アルキルもしくはアルケニル基、または

トリフルオロメチル、ニトリル、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシアルコキシ、インドリル、チオフェニル、オキソチオフェニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>N-アルキルまたはN-ジアルキルカルバモイル基、または

フェニル、アロイル、ベンジルオキシまたはN-アリールカルバモイル基(これについて、フェニル環は、場合によっては直鎖状または分岐状のC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、ニトロ基、ハロゲン原子のような1個以上の基で置換されている)

のような基で置換されたC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル基、

場合によってはハロゲン原子、ニトロ、ニトリル、トリフルオロメチル、ビニル、メチルスルファニル、直鎖状または分岐状のC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、直鎖状または分岐状のC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ、フェニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>N-モノ-またはジ-アルキルカルバモイル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルカルボキサミド基のような1個以上の基で置換されているフェニル、ピリジル、ナフチルまたはチオフェニル基、

場合によってはフェニル基と融合したC<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>2-オキソシクロアルキル基を表し、

m、nは、1であり、

Vは、CH<sub>2</sub>を表し、

X-Yは、-N-(C=O)-、-CH-CH<sub>2</sub>-、-CH-O-、-CH-(C=O)-を表し、

Zは、1個以上のトリフルオロメチル基、ハロゲン原子、直鎖状または分岐状のC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、直鎖状または分岐状のC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ基で置換されたフェニル基を表す)。

## 【請求項4】

一般式Iに対応する請求項2に記載の2H-[1,2,4]トリアジン-3,5-ジオンおよびH-ピリミジン-2,4-ジオンの誘導体：

(ここで、式I中、

Wは、窒素またはCHを表し、

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は、

水素(非同時的に)または直鎖状もしくは分岐状のC<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>アルキル基、または

トリフルオロメチル、ニトリル、ヒドロキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシアルコキシ、インドリル、オキソチオフェニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>N-アルキルまたはN-ジアルキルカルバモイル基のような基で置換されたC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル基、

場合によってはハロゲン原子、ニトロ、ニトリル、トリフルオロメチル、ビニル、メチルスルファニル、直鎖状または分岐状のC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、直鎖状または分岐状のC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>N-モノ-またはジ-アルキルカルバモイル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルカルボキサミド基のような1個以上の基で置換されたフェニル、ピリジル、ナフチルまたはチオフェニル基、

場合によってはフェニル基と融合したC<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>2-オキソシクロアルキル基を表し、

m、nは1であり、

Vは、CH<sub>2</sub>を表し、

X-Yは、-N-(C=O)-、-CH-O-を表し、

Zは、1個以上のトリフルオロメチル基、ハロゲン原子、直鎖状または分岐状のC<sub>1</sub>-

$C_4$  アルキル基で置換されたフェニル基を表す)。

【請求項 5】

一般式 I に対応する請求項 2 に記載の  $2H - [1, 2, 4]$  トリアジン - 3, 5 - ジオンの誘導体:

(ここで、式 I 中、

W は、窒素を表し、

$R_1$  は、

水素または直鎖状もしくは分岐状の  $C_1 - C_5$  アルキル基、または

トリフルオロメチル、ニトリル、ヒドロキシ、 $C_1 - C_3$  アルコキシ、 $C_3 - C_6$  アルコキシアルコキシ、インドリル、オキソチオフェニル、 $C_1 - C_3 N$  - アルキルカルバモイル基のような基で置換された  $C_1 - C_3$  アルキル基、

場合によってはハロゲン原子、ニトロ、ニトリル、トリフルオロメチル、ビニル、メチルスルファニル、直鎖状または分岐状の  $C_1 - C_4$  アルキル、直鎖状または分岐状の  $C_1 - C_3$  アルコキシ、フェニル、 $C_1 - C_3 N$  - モノ - またはジ - アルキルカルバモイル、 $C_1 - C_4$  アルキルカルボキサミド基のような 1 個以上の基で置換されたフェニル、ピリジル、ナフチルまたはチオフェニル基、

$C_5 - C_6 2 - \text{オキソシクロアルキル基}$

を表し、

$R_2$  は、直鎖状または分岐状の  $C_1 - C_7$  アルキル基を表し、

m、n は、1 であり、

V は、 $C H_2$  を表し、

X - Y は、 $-N - (C = O) -$ 、 $-CH - O -$  を表し、

Z は、1 個以上のトリフルオロメチル基、ハロゲン原子、または直鎖状  $C_1 - C_4$  アルキル基で置換されたフェニル基を表す)。

【請求項 6】

$R_2$  はメチル基を表す、請求項 5 に記載の誘導体。

【請求項 7】

一般式 I に対応する請求項 2 に記載の  $2H - [1, 2, 4]$  トリアジン - 3, 5 - ジオンの誘導体:

(ここで、式 I 中、

W は、窒素であり、

$R_1$  は、

水素または直鎖状もしくは分岐状の  $C_1 - C_5$  アルキル基、または

トリフルオロメチル、ニトリル、ヒドロキシ、 $C_1 - C_3$  アルコキシ、 $C_3 - C_6$  アルコキシアルコキシ、インドリル、オキソチオフェニル、 $C_1 - C_3 N$  - アルキルカルバモイル基のような基で置換された  $C_1 - C_3$  アルキル基、

ハロゲン原子、ニトリル、直鎖状または分岐状の  $C_1 - C_4$  アルキル、直鎖状または分岐状の  $C_1 - C_3$  アルコキシ基のような 1 個以上の基で置換されることがあるフェニル、ピリジルまたはチオフェニル基、

$C_6 2 - \text{オキソシクロアルキル基}$

を表し、

$R_2$  は、メチルまたはヘプチルを表し、

m、n は、1 であり、

V は、 $C H_2$  を表し、

X - Y は、 $-N - (C = O) -$ 、 $-CH - O -$  を表し、

Z は、1 個以上のトリフルオロメチル基、ハロゲン原子または直鎖状  $C_1 - C_4$  アルキル基で置換されたフェニル基を表す)。

【請求項 8】

下記から選択されることを特徴とする請求項 2 に記載の一般式 I の誘導体:

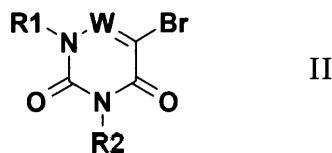
4 - ヘプチル - 2 - メチル - 6 - [4 - (2 - トリフルオロメチル - ベンゾイル) - ピ

ペラジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
2 - メチル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - ベンゾイル ) - ピペラジン - 1 -  
イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
4 - メチル - 2 - ( 4 , 4 , 4 - トリフルオロ - ブチル ) - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフル  
オロメチル - ベンゾイル ) - ピペラジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン  
- 3 , 5 - ジオン、  
4 - メチル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - ベンゾイル ) - ピペラジン - 1 -  
イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
2 , 4 - ジメチル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - ベンゾイル ) - ピペラジン  
- 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
2 , 4 - ジメチル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - フェノキシ ) - ピペリジン  
- 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
3 - { 4 - ヘプチル - 3 , 5 - ジオキソ - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - フェ  
ノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 3 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジ  
ン - 2 - イル } - プロピオニトリル、  
2 - ブチル - 4 - メチル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - フェノキシ ) - ピペ  
リジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
N - メチル - 2 - { 4 - メチル - 3 , 5 - ジオキソ - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメ  
チル - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 3 H - [ 1 , 2 , 4  
] トリアジン - 2 - イル } - アセタミド、  
2 - ( 2 - エトキシ - エチル ) - 4 - メチル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル -  
フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジ  
オン、  
2 - [ 2 - ( 1 H - インドール - 3 - イル ) - エチル ] - 4 - メチル - 6 - [ 4 - ( 2  
- トリフルオロメチル - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ]  
トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
4 - メチル - 2 - ( 4 - オキソ - 4 - チオフェン - 2 - イル - ブチル ) - 6 - [ 4 - ( 2  
- トリフルオロメチル - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ]  
トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
3 - { 6 - [ 4 - ( 2 - クロロ - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 4 - メチル  
- 3 , 5 - ジオキソ - 4 , 5 - ジヒドロ - 3 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 2 - イル }  
- プロピオニトリル、  
6 - [ 4 - ( 2 - クロロ - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 4 - メチル - 2 -  
( 4 , 4 , 4 - トリフルオロ - ブチル ) - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジ  
オン、  
6 - [ 4 - ( 2 - クロロ - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2 , 4 - ジメチル  
- 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
6 - [ 4 - ( 2 - フルオロ - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2 , 4 - ジメチ  
ル - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
6 - [ 4 - ( 2 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 -  
イル ] - 2 , 4 - ジメチル - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
6 - [ 4 - ( 2 - クロロ - 5 - フルオロ - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2  
, 4 - ジメチル - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
2 , 4 - ジメチル - 6 - ( 4 - o - トリルオキシ - ピペリジン - 1 - イル ) - 2 H - [  
1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
6 - [ 4 - ( 4 - フルオロ - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2 , 4 - ジメチ  
ル - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
6 - [ 4 - ( 5 - フルオロ - 2 - トリフルオロメチル - ベンゾイル ) - ピペラジン - 1  
- イル ] - 2 , 4 - ジメチル - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
6 - [ 4 - ( 5 - フルオロ - 2 - トリフルオロメチル - ベンゾイル ) - ピペラジン - 1

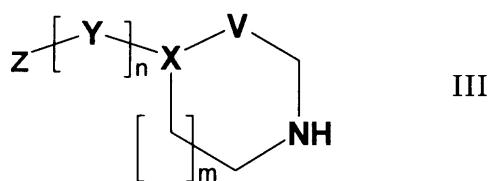
- イル ] - 4 - メチル - 2 - ( 4 , 4 , 4 - トリフルオロ - ブチル ) - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 6 - [ 4 - ( 5 - フルオロ - 2 - トリフルオロメチル - ベンゾイル ) - ピペラジン - 1 - イル ] - 4 - メチル - 2 - ( 3 - メチル - ブチル ) - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 2 , 4 - ジメチル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - ベンジル ) - ピペラジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 4 - メチル - 2 - ( 4 , 4 , 4 - トリフルオロ - ブチル ) - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - ベンジル ) - ピペラジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 4 - メチル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - ベンジル ) - ピペラジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 6 - [ 4 - ( 5 - フルオロ - 2 - トリフルオロメチル - ベンゾイル ) - ピペラジン - 1 - イル ] - 4 - メチル - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 6 - [ 4 - ( 4 - フルオロ - 2 - トリフルオロメチル - ベンゾイル ) - ピペラジン - 1 - イル ] - 4 - メチル - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 6 - [ 4 - ( 4 - フルオロ - 2 - トリフルオロメチル - ベンジル ) - ピペラジン - 1 - イル ] - 4 - メチル - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 2 - ブチル - 4 - メチル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - ベンゾイル ) - ピペラジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 6 - [ 4 - ( 2 - クロロ - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 4 - ヘプチル - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 4 - メチル - 2 - o - トリル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 2 - ( 4 - フルオロ - フェニル ) - 4 - メチル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 4 - メチル - 2 - ピリジン - 3 - イル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 4 - メチル - 2 - チオフェン - 3 - イル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 4 - { 4 - メチル - 3 , 5 - ジオキソ - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 3 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 2 - イル } - ベンゾニトリル、  
 2 - ( 2 - メトキシ - フェニル ) - 4 - メチル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 4 - メチル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 4 - メチル - 2 - ( 2 - オキソ - シクロヘキシル ) - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 2 - [ 2 - ( 2 - エトキシ - エトキシ ) - エチル ] - 4 - メチル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン、  
 2 - ( 2 - ヒドロキシ - エチル ) - 4 - メチル - 6 - [ 4 - ( 2 - トリフルオロメチル - フェノキシ ) - ピペリジン - 1 - イル ] - 2 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアジン - 3 , 5 - ジオン。

【請求項 9】

一般式 I I  
【化 2】

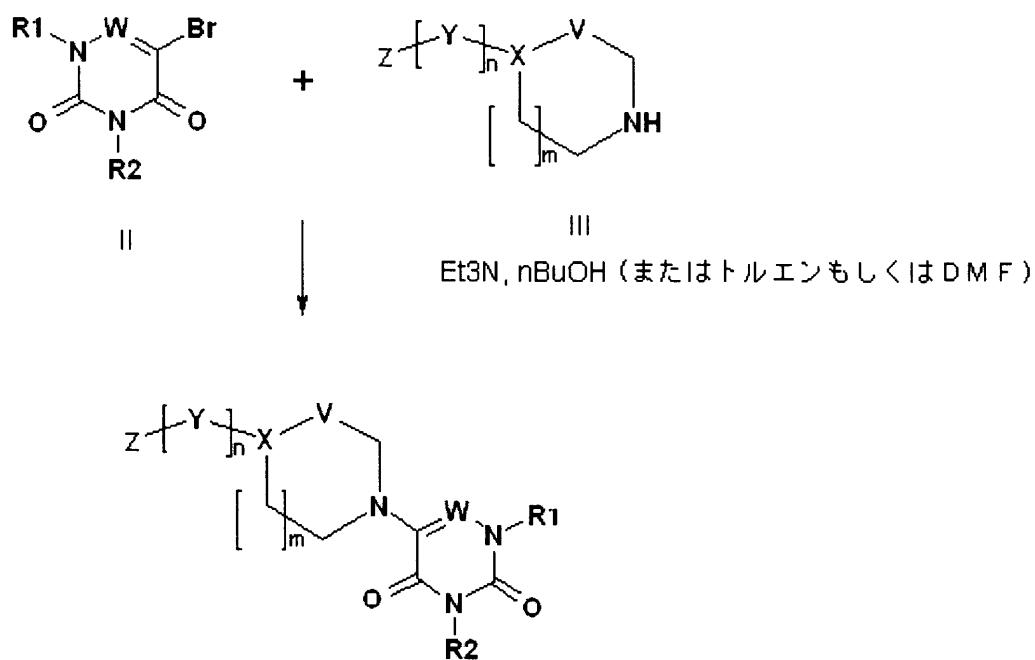


(上記式中、  
W、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は、式Iで上記した通りの基を表す)  
の誘導体を、一般式I I I  
【化 3】



(上記式中、  
m、n、X、Y、VおよびZは、式Iで上記した通りである)  
の誘導体と融合させることを特徴とする(工程図1)、請求項2~7のいずれか一項に記載の化合物の調製方法。

## 【化 4】

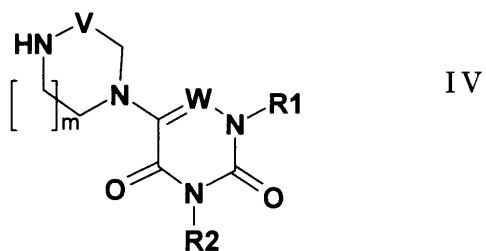
工程図1

## 【請求項10】

融合反応が、n-ブタノール、トルエンまたはジメチルホルムアミド中でトリエチルアミンのような塩基の存在下にて行われる、請求項9に記載の方法。

## 【請求項11】

一般式 I V  
【化 5】

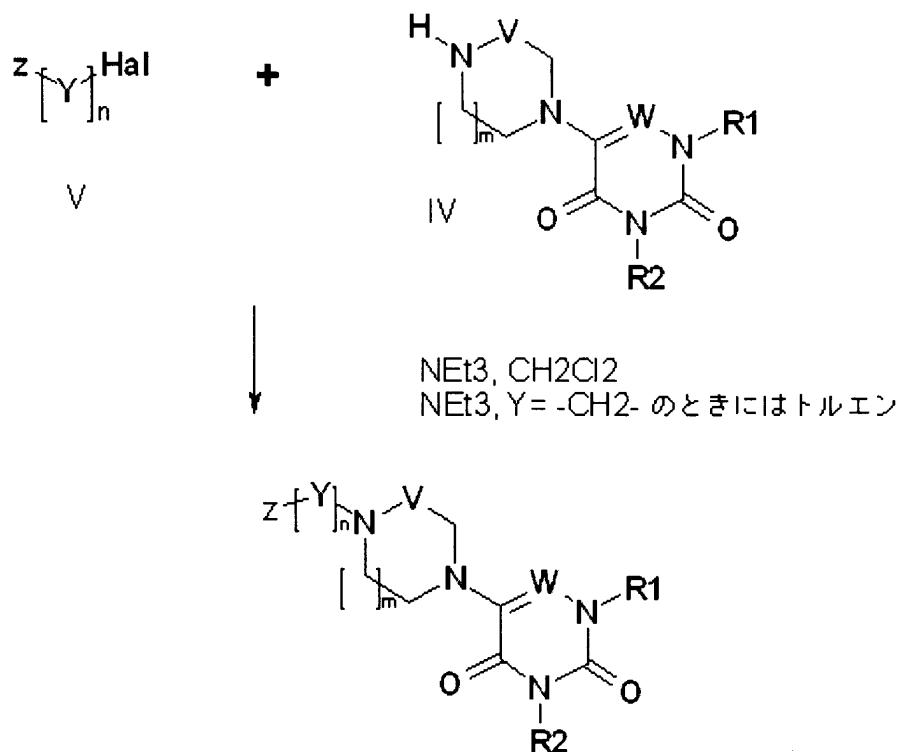


(上記式中、  
m、V、W、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は、式Iで上記した通りである)  
の誘導体を、一般式V  
【化 6】



(上記式中、  
Halは、Cl、BrまたはIのようなハロゲンを表し、  
n = 1であるときには、Yは、-(C=O)-、-CH<sub>2</sub>-、-O-(C=O)-を表し、  
n = 0であるときには、Yは、-CH=CH-(C=O)-、-C-(CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>)-(C=O)-を表し、  
Zは、式Iで上記した通りである)  
の化合物と融合させることを特徴とする(工程図2)、請求項2~7のいずれか一項に記載の一般式I(式中、Xは窒素を表す)の調製方法。

【化7】



工程図2

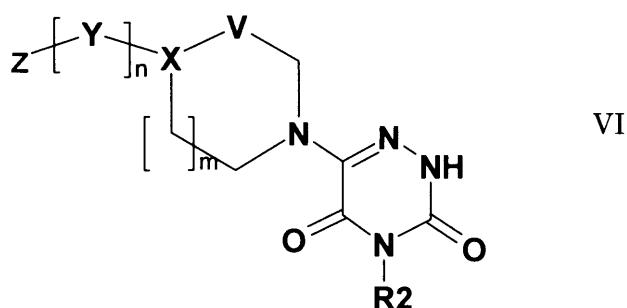
## 【請求項12】

融合反応が、ジクロロメタンまたはトルエン（Yが-CH<sub>2</sub>-であるとき）中でトリエチルアミンの存在下にて行われる、請求項11に記載の方法。

## 【請求項13】

R<sub>1</sub>が水素を表す請求項8に記載の方法（工程図1）に従って得られた化合物VI

【化8】



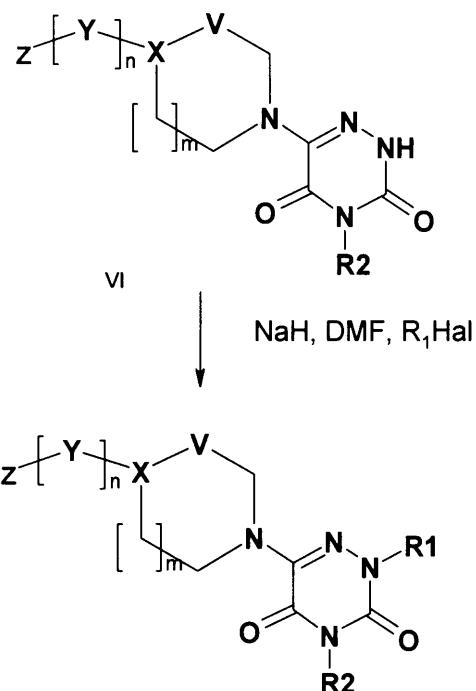
（上記式中、

X、Y、V、Z、m、nおよびR<sub>2</sub>は、式Iで上記した通りである）  
の窒素を、一般式R<sub>1</sub>H<sub>al</sub>

（上記式中、

H<sub>al</sub>は、Cl、BrまたはIのようなハロゲンを表し、R<sub>1</sub>は、一般式Iで上記した通りである）  
のハロゲン化誘導体によってジメチルホルムアミド中でNaHまたはtBuOKのような操作条件下にてアルキル化することを特徴とする、請求項2～7のいずれか一項に記載の一般式I（式中、Wは、窒素を表す）の化合物の調製方法。

## 【化9】



工程図3

## 【請求項14】

請求項1～7のいずれか一項に記載の一般式(I)の化合物を活性成分として含む、医薬組成物。

## 【請求項15】

請求項1～7のいずれか一項に記載の一般式(I)の化合物を任意の適当な賦形剤と共に含む、医薬組成物。

## 【請求項16】

S C D - 1 酵素活性の阻害剤を必要とする疾患の治療のための、請求項14または15に記載の医薬組成物。

## 【請求項17】

肥満、糖尿病性脂質代謝異常、高トリグリセリド血症、高コレステロール血症、代謝異常症候群、アテローム性動脈硬化症、肝臓脂肪症、心血管系発症リスクのような疾患の治療のための、請求項14または15に記載の医薬組成物。

## 【請求項18】

皮膚の脂質異常に関連した病状の治療のための、請求項14または15に記載の医薬組成物。

## 【請求項19】

にきび、乾癬、多毛症のような疾患の治療のための、請求項14または15に記載の医薬組成物。