

【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26年5月22日 (2014.5.22)

【公表番号】特表2013-525369(P2013-525369A)

【公表日】平成25年6月20日 (2013.6.20)

【年通号数】公開・登録公報2013-032

【出願番号】特願2013-506294(P2013-506294)

【国際特許分類】

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/4245 (2006.01)

C 0 7 D 413/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 409/14

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 K 31/4245

C 0 7 D 413/04 C S P

C 0 7 D 413/14

A 6 1 K 31/4439

C 0 7 D 417/14

A 6 1 K 31/427

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/497

【手続補正書】

【提出日】平成26年4月4日 (2014.4.4)

【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

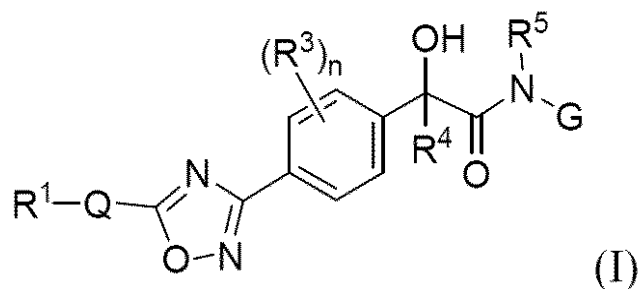
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

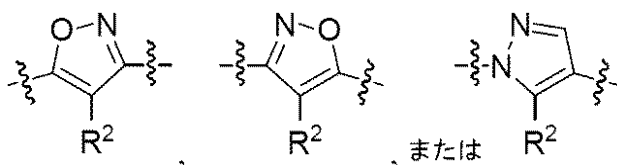
【化 1】



[式中、

Q は、

【化 2】



であり；

R¹ は：(i) C₃ - 6 アルキル；

(i i) ハロ、- CN、C₁ - 4 アルキル、C₁ - 4 アルコキシ、C₁ - 3 フルオロアルキル、C₁ - 3 クロロアルキル、および / または C₁ - 2 フルオロアルコキシから独立して選択される 0 から 3 個の置換基で置換された C₃ - 7 シクロアルキル；

(i i i) ハロ、- CN、C₁ - 4 アルキル、C₃ - 6 シクロアルキル、C₁ - 4 アルコキシ、C₁ - 3 フルオロアルキル、C₁ - 3 クロロアルキル、および / または C₁ - 2 フルオロアルコキシから独立して選択される 0 から 3 個の置換基で置換されたフェニル；または

(i v) ハロ、- CN、C₁ - 4 アルキル、C₃ - 6 シクロアルキル、C₁ - 4 アルコキシ、C₁ - 3 フルオロアルキル、C₁ - 3 クロロアルキル、および / または C₁ - 2 フルオロアルコキシから独立して選択される 0 から 3 個の置換基で置換されたピリジニルであり；

R² は、ハロ、- CN、C₁ - 4 アルキル、C₃ - 6 シクロアルキル、C₁ - 4 アルコキシ、C₁ - 3 フルオロアルキル、C₁ - 3 クロロアルキル、および / または C₁ - 2 フルオロアルコキシから独立して選択される 0 から 3 個の置換基で置換された C₁ - 6 アルキル、C₁ - 3 フルオロアルキル、C₃ - 7 シクロアルキル、またはフェニルであり；

n は、0、1、または 2 であり；

各 R³ は、独立して、C₁ - 3 アルキル、F、Cl、C₁ - 3 フルオロアルキル、C₁ - 3 クロロアルキル、- CN、C₁ - 3 アルコキシ、および / または C₁ - 3 フルオロアルコキシであり；

R⁴ は、H または - CH₃ であり；R⁵ は、H または - CH₃ であり；

G は：

(i) H、C₁ - 6 アルキル、または C₃ - 6 シクロアルキル；

(i i) - NH₂、C₁ - 6 アルコキシ、- C (O) OH、- C (O) O (C₁ - 6 アルキル)、または - S (O)₂ C₁ - 6 アルキルで置換された C₁ - 6 アルキル；

(i i i) - OH、- CN、および / またはシクロプロピルから選択される 1 個またはそれ以上の置換基で置換された C₁ - 6 アルキル；

(i v) - (CH₂)_{0 - 3} - R^a (ここで、R^a は、- OH、- CN、および / または - CH₂ OH から独立して選択される 0 から 2 個の置換基で置換された C₃ - 6 シクロア

ルキルである) ;

(v) - (CH₂)₀₋₃ - R^b (ここで、R^b は、-OH、C₁₋₃ ヒドロキシアルキル、および / または -S(O)₂NH₂ から独立して選択される 0 から 2 個の置換基で置換されたフェニルである) ;

(vi) - (CH₂)₁₋₃ C(O)NR^cR^d (ここで、R^c は H または -CH₃ であり ; R^d は、H、C₁₋₆ アルキル、C₃₋₆ シクロアルキル、C₁₋₆ ヒドロキシアルキル、- (CH₂)₀₋₂ (ヘテロアリール)、または - (CH₂)₀₋₂ (ヘテロシクリル) である) ;

(vii) - CH(CN)R^e (ここで、R^e は、フェニル、ベンジル、-C(O)NH₂、または -C(O)NH(C₁₋₃ アルキル) である) ;

(viii) - CHR^fC(O)NH(CH₃) (ここで、R^f は、C₁₋₆ アルキル、-CN、フェニル、ベンジル、または -CH₂CH₂-フェニルである) ;

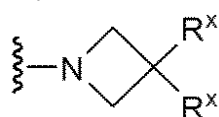
(ix) - (CH₂)₁₋₃ NHC(O)R^g (ここで、R^g は、C₁₋₆ アルキルまたは -O(C₁₋₆ アルキル) である) ;

(x) - CHR^h - (CH₂)₀₋₃ - Rⁱ (ここで、R^h は、H または -CH₃ であり、Rⁱ はヘテロアリールである) ;

(xi) - (CH₂)₀₋₃ - R^j (ここで、R^j はヘテロシクリルである) ; または

(xii) - (CH₂)₁₋₃ C(O) - R^k (ここで、R^k は、

【化 3】



であり、各 R^x は、独立して、H、F、-OH、-CH₃、-OCH₃、および / または -C(O)OCH₃ から選択される) であり ;

ここで、各該ヘテロアリール基は、C₁₋₃ アルキル、-OH、-NH₂、フェニル、メチルフェニル、ベンジル、-CH₂CH₂-フェニル、ピリジニル、-C(O)OC₁₋₃ アルキル、および / または -CH₂OCH₃ から独立して選択される 0 から 3 個の置換基で置換され ;

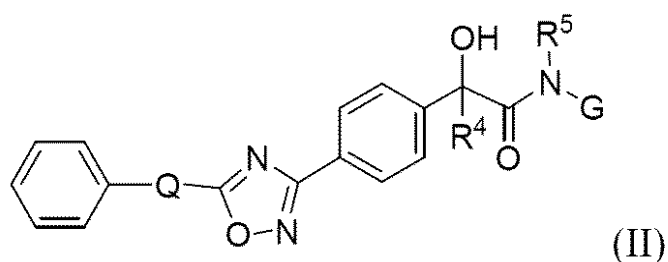
ここで、各該ヘテロシクリル基は、C₁₋₃ アルキル、-OH、-NH₂、フェニル、メチルフェニル、ベンジル、-CH₂CH₂-フェニル、ピリジニル、-C(O)OC₁₋₃ アルキル、=O、および / または -CH₂OCH₃ から独立して選択される 0 から 3 個の置換基で置換される]

の化合物、またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 2】

式 (II) :

【化 4】



[式中、

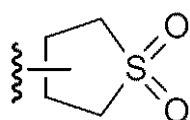
R² は -CF₃ であり ;

R⁴ は、H または -CH₃ であり ;

R⁵ は、H または -CH₃ であり ;

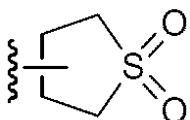
G は：

- (i) H、 C_{1-3} アルキル、またはシクロブチル；
 - (ii) $-NH_2$ 、 $-OCH_3$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)O(C_{1-4}$ アルキル)、または $-S(O)_2CH_3$ で置換された C_{1-2} アルキル；
 - (iii) C_{2-6} ヒドロキシアルキルまたは C_{1-4} シアノアルキル；
 - (iv) $-(CH_2)_{0-2}-R^a$ (ここで、 R^a は、 $-OH$ 、 $-CN$ 、および $-CH_2OH$ から選択される 0 または 1 個の置換基で置換された C_{3-6} シクロアルキルである)；
 - (v) $-(CH_2)_{0-2}-R^b$ (ここで、 R^b は、 $-OH$ 、 C_{1-2} ヒドロキシアルキル、および $-S(O)_2NH_2$ から選択される 0 または 1 個の置換基で置換されたフェニルである)；
 - (vi) $-(CH_2)_{1-2}C(O)NR^cR^d$ (ここで、 R^c は、H または $-CH_3$ であり； R^d は、H、 C_{1-4} アルキル、シクロプロピル、 $-CH_2C(CH_3)_2(OH)$ 、 $-CH_2$ (イミダゾリル)、N-メチルアセチジニル、または
- 【化 5】



- である)；
- (vii) $-CH(CN)R^e$ (ここで、 R^e は、フェニル、ベンジル、 $-C(O)NH_2$ 、 $-C(O)NH(CH_3)$ 、または $-C(O)NH$ (イソプロピル) である)；
 - (viii) $-CHR^fC(O)NH(CH_3)$ (ここで、 R^f は、 $-CH_3$ 、t-ブチル、 $-CN$ 、または $-CH_2CH_2$ -フェニルである)；
 - (ix) $-CH_2CH_2NHC(O)R^g$ (ここで、 R^g は、 $-CH_3$ または $-O$ (t-ブチル) である)；
 - (x) $-CHR^h-(CH_2)_{0-2}-R^i$ (ここで、 R^h は、H または $-CH_3$ であり、 R^i は、それぞれ C_{1-3} アルキル、 $-NH_2$ 、フェニル、メチルフェニル、ベンジル、 $-CH_2CH_2$ -フェニル、ピリジニル、 $-C(O)OCH_2CH_3$ 、および / または $-CH_2OCH_3$ から独立して選択される 0 から 3 個の置換基で置換されたピロリル、チオフェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、テトラゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、インドリル、またはベンゾイミダゾリルである)；
 - (xi) $-(CH_2)_{0-3}-R^j$ (ここで、 R^j は、アセチジニル、ピロリジニル、N-メチルピロリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、イミダゾリジニル、または

【化 6】



- である)；または
- (xii) $-CH_2CH_2C(O)-R^k$ (ここで、 R^k は、

【化 7】

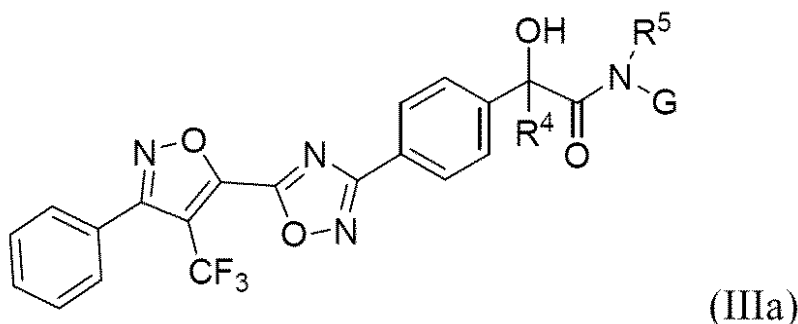


- であり、各 R^x は、独立して、H、F、 $-OH$ 、 $-CH_3$ 、 $-OCH_3$ 、および / または $-C(O)OCH_3$ から選択される) である]
- を有する、請求項 1 に記載される化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 3】

式 (IIIa) :

【化 8】

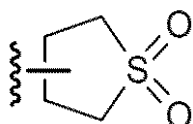


[式中、

G は :

- (i) H、 C_{1-2} アルキル、またはシクロブチル ;
- (ii) $-NH_2$ 、 $-OCH_3$ 、 $-C(O)OH$ または $-S(O)_2CH_3$ で置換された C_{1-2} アルキル ;
- (iii) C_{2-5} ヒドロキシアルキルまたは C_{1-4} シアノアルキル ;
- (iv) $-CN$ で置換されたシクロプロピル ;
- (v) $-(CH_2)_{1-2}C(O)NR^cR^d$ (ここで、 R^c は H または $-CH_3$ であり、 R^d は、H、 C_{1-4} アルキル、シクロプロピル、 $-CH_2C(CH_3)_2(OH)$ 、 $-CH_2$ (イミダゾリル)、N-メチルアセチジニル、または

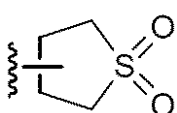
【化 9】



である) ;

- (vi) $-CH(CN)R^e$ (ここで、 R^e は、フェニル、ベンジル、または $-C(O)NH_2$ である) ;
- (vii) $-CHR^fC(O)NH(CH_3)$ (ここで、 R^f は、 $-CH_3$ 、t-ブチル、 $-CN$ 、または $-CH_2CH_2$ -フェニルである) ;
- (viii) $-CH_2CH_2NHC(O)R^g$ (ここで、 R^g は、 $-CH_3$ または $-O$ (t-ブチル) である) ;
- (ix) $-CHR^h-(CH_2)_{0-2}-R^i$ (ここで、 R^h は H または $-CH_3$ であり、 R^i は、それぞれ C_{1-3} アルキル、 $-NH_2$ 、フェニル、メチルフェニル、ベンジル、 $-CH_2CH_2$ -フェニル、ピリジニル、 $-C(O)OCH_2CH_3$ 、および / または $-CH_2OCH_3$ から独立して選択される 0 から 3 個の置換基で置換されたピロリル、チオフェニル、ピラゾリル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、トリアゾリル、オキサジアゾリル、テトラゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、インドリル、またはベンゾイミダゾリルである) ;
- (x) $-(CH_2)_{0-3}-R^j$ (ここで、 R^j は、アセチジニル、ピロリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、イミダゾリジノニル、または

【化 10】



である) ; または

- (xi) $CH_2CH_2C(O)-R^k$ (ここで、 R^k は

【化 1 1】



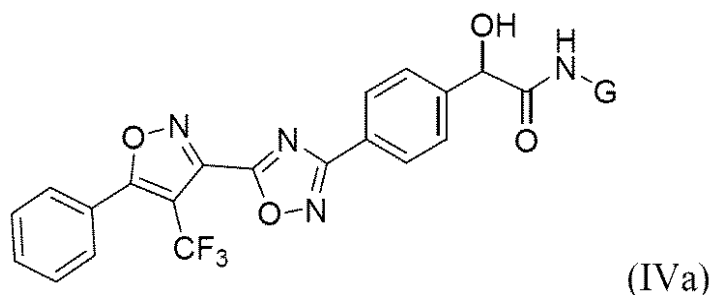
であり、各 R^x は、独立して、H、F、 $-OH$ 、 $-CH_3$ 、 $-OCH_3$ 、および / または $-C(O)OCH_3$ である) である]

を有する、請求項 2 に記載される化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 4】

式 (IVa) :

【化 1 2】



[式中、

G は :

(i) エチル ;

(i i) C_{2-4} ヒドロキシアルキル ;

(i i i) $-CH_2C(O)NHR^d$ (ここで、 R^d は、 $-CH_3$ または $-CH_2CH_3$ である) ; または

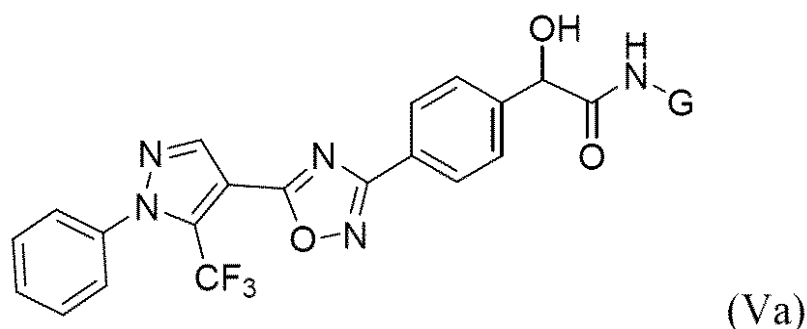
(i v) $-CH_2(CH_2)_{0-2}-R^i$ (ここで、 R^i は、イミダゾリルまたはピリジニルである) である]

を有する、請求項 2 に記載される化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 5】

式 (Va) :

【化 1 3】



[式中、

G は :

(i) C_{1-3} アルキル ;

(i i) $-C(O)OH$ または $-C(O)O(C_{1-4} \text{ アルキル})$ で置換されたメチル ;

(i i i) C_{2-6} ヒドロキシアルキル ;

(i v) $-(CH_2)_{0-2}-R^a$ (ここで、 R^a は、 $-OH$ および $-CH_2OH$ から選択される 0 または 1 個の置換基で置換された C_{3-6} シクロアルキルである) ;

(v) $-(CH_2)_{0-2}-R^b$ (ここで、 R^b は、 $-OH$ 、 C_{1-2} ヒドロキシアルキル、および $-S(O)_2NH_2$ から選択される 0 または 1 個の置換基で置換されたフェニルである) ;

(v i) $-CH_2CH_2C(O)NH_2$;

(v i i i) - CH₂ - (ピリジニル) ; または
(v i i) - (CH₂)₂ - R^j (ここで、R^j は、ピロリジニルまたは N - メチルピロリジニルである) である]

を有する、請求項 2 に記載される化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 6】

該化合物が、

2 - ヒドロキシ - N - (2 - (メチルアミノ) - 2 - オキソエチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1) ;

N - (2 - アミノ - 2 - オキソエチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (2) ;

2 - ヒドロキシ - N - (2 - ヒドロキシエチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (3) ;

3 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) プロパン酸 (4) ;

N - (シアノメチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (5) ;

3 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) - N - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) プロパンアミド (6) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((3 - メチルイソオキサゾール - 5 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (7) ;

2 - ヒドロキシ - N - (オキサゾール - 5 - イルメチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (8) ;

N - ((4 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル) メチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (9) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((5 - メチル - 1 , 3 , 4 - オキサジアゾール - 2 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (10) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (11) ;

N - (2 - (エチルアミノ) - 2 - オキソエチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (12) ;

N - エチル - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (13) ;

N - (シアノメチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (14) ;

N - (3 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル) プロピル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド - T F A (1 5) ;

2 - ヒドロキシ - N - メチル - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 6) ;

N - ((1 H - イミダゾール - 2 - イル) メチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド - T F A (1 7) ;

2 - ヒドロキシ - N - (2 - (メチルアミノ) - 2 - オキソエチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 8) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド - T F A (1 9) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 5 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド - T F A (2 0) ;

2 - ヒドロキシ - N - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (2 1) ;

3 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) プロパン酸 (2 2) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - (3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロピル) アセトアミド (2 3) ;

N - エチル - 2 - ヒドロキシ - N - メチル - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (2 4) ;

(2 S) - 2 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) - N , 3 , 3 - トリメチルブタンアミド (2 5) ;

(2 S) - 2 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) - N - メチル - 4 - フェニルブタンアミド (2 6) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - ((S) - テトラヒドロフラン - 3 - イル) アセトアミド (2 7) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イル) アセトアミド (2 8) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - ((R) - テトラヒドロフラン - 3 - イル) アセトアミド (2 9) ;

N - (アゼチジン - 3 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾ

ール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド - T F A (3 0) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソ
オキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N
- (3 , 3 - ジオキシド - テトラヒドロチオフエン - 3 - イル) アセトアミド (3 1) ;

2 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル)
イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル
) アセトアミド) - N - メチルプロパンアミド (3 2) ;

2 - ヒドロキシ - N - (2 - (1 - メチルアゼチジン - 3 - イルアミノ) - 2 - オキソ
エチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾ
ール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド
(3 3) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソ
オキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N
- (ピリジン - 2 - イルメチル) アセトアミド (3 4) ;

2 - ヒドロキシ - N - (2 - (メチルスルホニル) エチル) - 2 - (4 - (5 - (3 -
フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オ
キサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (3 5) ;

2 - ヒドロキシ - N - (2 - オキソ - 2 - (1 , 1 - ジオキシド - テトラヒドロチオフ
エン - 3 - イルアミノ) エチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオ
ロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル)
フェニル) アセトアミド (3 6) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソ
オキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N
- (2 - (チアゾール - 4 - イル) エチル) アセトアミド (3 7) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル) メチル) - 2
- (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イ
ル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (3 8) ;

N - ((R) - 1 - シアノエチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニ
ル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジ
アゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (3 9) ;

N - ((S) - 1 - シアノエチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニ
ル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジ
アゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (4 0) ;

N - (1 - シアノシクロプロピル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニ
ル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジ
アゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (4 1) ;

N - (1 , 3 - ジヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5
- (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2
, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (4 2) ;

N - (2 - シアノプロパン - 2 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェ
ニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキ
サジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (4 3) ;

N - ((S) - 1 - シアノ - 2 - メチルプロピル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5
- (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2
, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (4 4) ;

N - ((R) - 1 - シアノ - 2 - メチルプロピル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5
- (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2
, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (4 5) ;

N - ((S) - 1 - シアノエチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニ
ル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジ

アゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (4 6) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((S) - 2 - ヒドロキシプロピル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (4 7) ;

N - (2 , 3 - ジヒドロキシプロピル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (4 8) ;

2 - ヒドロキシ - N - (3 - ヒドロキシプロピル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (4 9) ;

2 - ヒドロキシ - N - (2 - メトキシエチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (5 0) ;

t e r t - ブチル 2 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) エチルカルバメート (5 1) ;

N - (2 - アミノエチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド , T F A (5 2) ;

N - (2 - アセトアミドエチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (5 9) ;

2 - ヒドロキシ - N - (2 - ヒドロキシエチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (7 1) ;

2 - ヒドロキシ - N - (2 - (メチルアミノ) - 2 - オキソエチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (7 2) ;

N - ((2 - アミノチアゾール - 4 - イル) メチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド - T F A (7 3) ;

3 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) - N , N - ジメチルプロパンアミド (7 4) ;

3 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) - N - メチルプロパンアミド (7 5) ;

N - エチル - 3 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) プロパンアミド (7 6) ;

3 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) - N , N - ジメチルプロパンアミド (7 7) ;

N - t e r t - ブチル - 3 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) プロパンアミド (7 8) ;

N - シクロプロピル - 3 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) プロパンアミド (7 9) ;

3 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル

) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル)
アセトアミド) - N - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) プロパンアミド (8 0) ;

N - ((1 H - イミダゾール - 2 - イル) メチル) - 3 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) プロパンアミド, T F A (8 1) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - (チオフェン - 3 - イルメチル) アセトアミド (8 2) ;

N - ((4 - アミノ - 2 - メチルピリミジン - 5 - イル) メチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (8 3) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - ((1, 3, 5 - トリメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) メチル) アセトアミド (8 4) ;

2 - ヒドロキシ - N - (2 - (2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル) エチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (8 5) ;

N - ((1 H - インドール - 2 - イル) メチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (8 6) ;

N - ((1 H - テトラゾール - 5 - イル) メチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (8 7) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - (ピロリジン - 2 - イルメチル) アセトアミド, T F A (8 8) ;

N - (2 - (1 H - イミダゾール - 4 - イル) エチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド, T F A (8 9) ;

N - ((1 H - ベンゾ [d] イミダゾール - 2 - イル) メチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (9 0) ;

N - (3 - (3, 3 - ジフルオロアゼチジン - 1 - イル) - 3 - オキソプロピル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (9 1) ;

2 - ヒドロキシ - N - (3 - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルアゼチジン - 1 - イル) - 3 - オキソプロピル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (9 2) ;

2 - ヒドロキシ - N - (3 - (3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル) - 3 - オキソプロピル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (9 3) ;

N - ((4 - アミノ - 2 - メチルピリミジン - 5 - イル) メチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (9 4) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - (2 - (チアゾール - 4 - イル) エチル) アセトアミド (9 5) ;

2 - ヒドロキシ - N - (3 - (3 - メトキシアゼチジン - 1 - イル) - 3 - オキソプロピル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (9 6) ;

メチル 1 - (3 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) プロパノイル) アゼチジン - 3 - カルボキシレート (9 7) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - (チアゾール - 2 - イルメチル) アセトアミド (9 8) ;

2 - ヒドロキシ - N - (オキサゾール - 2 - イルメチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (9 9) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((5 - メチルイソオキサゾール - 3 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 0 0) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((5 - メチル - 4 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 0 1) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((4 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 0 2) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((3 - (メトキシメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 5 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 0 3) ;

2 - シアノ - 2 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) - N - メチルアセトアミド (1 0 4) ;

N - (1 - シアノ - 2 - フェニルエチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 0 5) ;

N - (シアノ (フェニル) メチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 0 6) ;

N - (2 - アミノ - 1 - シアノ - 2 - オキソエチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 0 7) ;

2 - ヒドロキシ - N - (1 - (4 - メチル - 4 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル) エチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 0 8) ;

N - ((1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) メチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド - T F A

(1 0 9) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((5 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド , T F A (1 1 0) ;

N - ((5) - 1 - (1 H - イミダゾール - 2 - イル) エチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド , T F A (1 1 1) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((5 - メチルイソオキサゾール - 3 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 1 2) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((4 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド , T F A (1 1 3) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド , T F A (1 1 4) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - (2 - (ピラジン - 2 - イル) エチル) アセトアミド , T F A (1 1 5) ;

N - シクロブチル - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 1 6) ;

2 - ヒドロキシ - N - (2 - (メチルスルホニル) エチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 1 7) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((5 - メチル - 4 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 1 8) ;

エチル 5 - ((2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) メチル) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - カルボキシレート (1 1 9) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((3 - イソプロピルイソオキサゾール - 5 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 2 0) ;

N - ((1 - エチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) メチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 2 1) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - ((1 - p - トリル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) メチル) アセトアミド (1 2 2) ;

N - ((1 - ベンジル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル) メチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 -

イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (123) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((1 - フェニル - 1H - ピラゾール - 4 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (124) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((4 - フェネチル - 4H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (125) ;

2 - ヒドロキシ - N - (オキサゾール - 5 - イルメチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (126) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - ((5 - (ピリジン - 2 - イル) チオフェン - 2 - イル) メチル) アセトアミド (127) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((5 - フェニル - 1, 3, 4 - オキサジアゾール - 2 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (128) ;

N - ((1 - ベンジル - 1H - ピラゾール - 4 - イル) メチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (129) ;

N - ((1, 5 - ジメチル - 1H - ピロール - 2 - イル) メチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (130) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((5 - メチル - 3 - フェニルイソオキサゾール - 4 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (131) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((1 - メチル - 1H - ピロール - 2 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (132) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((3 - メチルイソオキサゾール - 5 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (133) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((5 - メチル - 1, 3, 4 - オキサジアゾール - 2 - イル) メチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (134) ;

2 - ヒドロキシ - N - (2 - ヒドロキシエチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) プロパンアミド (159) ;

N - (シアノメチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) プロパンアミド (160) ;

および 2 - ヒドロキシ - N - (2 - (メチルスルホニル) エチル) - 2 - (4 - (5 - (3 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 5 - イル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) プロパンアミド (161)

から選択される、請求項 1 に記載される化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 7】

該化合物が、

2 - ヒドロキシ - N - (2 - ヒドロキシエチル) - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (5 3) ;

2 - ヒドロキシ - N - (3 - ヒドロキシプロピル) - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (5 4) ;

2 - ヒドロキシ - N - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (5 5) ;

tert - ブチル 2 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) アセテート (5 6) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((S) - 2 - ヒドロキシプロピル) - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (5 7) ;

2 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド) 酢酸 (5 8) ;

2 - ヒドロキシ - N - メチル - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (6 0) ;

N - エチル - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (6 1) ;

2 - ヒドロキシ - N - (2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エチル) - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 3 5) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - (2 - (ピロリジン - 1 - イル) エチル) アセトアミド (1 3 6) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - (ピリジン - 2 - イルメチル) アセトアミド (1 3 7) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - (ピリジン - 3 - イルメチル) アセトアミド (1 3 8) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - (ピリジン - 4 - イルメチル) アセトアミド (1 3 9) ;

2 - ヒドロキシ - N - (4 - (2 - ヒドロキシエチル) フェニル) - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 4 0) ;

2 - ヒドロキシ - N - (1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロパン - 2 - イル) - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 4 1) ;

2 - ヒドロキシ - N - (4 - ヒドロキシフェネチル) - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサ

ジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 4 2) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1
H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) -
N - (4 - スルファモイルフェネチル) アセトアミド (1 4 3) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1
H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) -
N - (4 - スルファモイルベンジル) アセトアミド (1 4 4) ;

N - (1 , 3 - ジヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5
- (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 ,
2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 4 5) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1
H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) -
N - プロピルアセトアミド (1 4 6) ;

3 - (2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル
- 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニ
ル) アセトアミド) プロパンアミド (1 4 7) ;

2 - ヒドロキシ - N - (4 - (ヒドロキシメチル) ベンジル) - 2 - (4 - (5 - (1
- フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4
- オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 4 8) ;

2 - ヒドロキシ - N - (1 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタン - 2 - イル) - 2 - (4
- (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル)
- 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 4 9) ;

2 - ヒドロキシ - N - (((1 R , 2 R) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) メチル)
- 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール -
4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 5
0) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((1 R , 2 S) - 2 - (ヒドロキシメチル) シクロヘキシル)
- 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール -
4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 5
1) ;

2 - ヒドロキシ - N - (((1 S , 2 R) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシル) メチル)
- 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール -
4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 5
2) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((1 R , 2 R) - 2 - (ヒドロキシメチル) シクロヘキシル)
- 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール -
4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 5
3) ;

2 - ヒドロキシ - N - (4 - ヒドロキシブチル) - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル -
5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジア
ゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 5 4) ;

2 - ヒドロキシ - N - (1 - (ヒドロキシメチル) シクロペンチル) - 2 - (4 - (5
- (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 ,
2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 5 5) ;

2 - ヒドロキシ - N - (3 - ヒドロキシベンジル) - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル
- 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジ
アゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 5 6) ;

2 - ヒドロキシ - N - (4 - ヒドロキシベンジル) - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル
- 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジ
アゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 5 7) ;

および 2 - ヒドロキシ - N - ((1 r , 4 r) - 4 - ヒドロキシシクロヘキシル) - 2 - (4 - (5 - (1 - フェニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (1 5 8) から選択される、請求項 1 に記載される化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 8】

該化合物が、

2 - ヒドロキシ - N - (2 - ヒドロキシエチル) - 2 - (4 - (5 - (5 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 3 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (6 2) ;

2 - ヒドロキシ - N - ((S) - 2 - ヒドロキシプロピル) - 2 - (4 - (5 - (5 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 3 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (6 3) ;

2 - ヒドロキシ - N - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 2 - (4 - (5 - (5 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 3 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (6 4) ;

N - (3 - (1 H - イミダゾール - 1 - イル) プロピル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (5 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 3 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド , T F A (6 5) ;

N - (2 - アミノ - 2 - オキソエチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (5 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 3 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (6 6) ;

N - エチル - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (5 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 3 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (6 7) ;

2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (5 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 3 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) - N - (ピリジン - 3 - イルメチル) アセトアミド - T F A (6 8) ;

2 - ヒドロキシ - N - (2 - (メチルアミノ) - 2 - オキソエチル) - 2 - (4 - (5 - (5 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 3 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (6 9) ;

および N - (2 - (エチルアミノ) - 2 - オキソエチル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (4 - (5 - (5 - フェニル - 4 - (トリフルオロメチル) イソオキサゾール - 3 - イル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル) アセトアミド (7 0)

から選択される、請求項 1 に記載される化合物またはその医薬的に許容される塩。

【請求項 9】

請求項 1 - 8 のいずれか一項に記載される化合物またはその立体異性体もしくは医薬的に許容される塩、および医薬的に許容される担体を含む、自己免疫疾患または慢性炎症性疾患の治療のための医薬組成物。

【請求項 10】

請求項 1 - 8 のいずれか一項に記載される化合物またはその立体異性体もしくは医薬的に許容される塩を含む、G タンパク質共役型受容体 S 1 P₁ の活性が関連する疾患または障害の治療剤。

【請求項 11】

自己免疫疾患または慢性炎症性疾患の治療剤の製造における、請求項 1 - 8 のいずれか一項に記載される化合物またはその立体異性体もしくは医薬的に許容される塩の使用。

【請求項 12】

別の治療薬を、請求項 1 - 8 のいずれか一項に記載される化合物またはその立体異性体もしくは医薬的に許容される塩と組み合わせて含む、自己免疫疾患または慢性炎症性疾患の治療剤であって、

該別の治療薬が、コルチコステロイドまたはグルココルチコイド；PDE 4 阻害剤；サイトカイン抑制性抗炎症剤（CSAID）、p38キナーゼ阻害剤、4-置換イミダゾ[1,2-A]キノキサリン類；細胞表面の分子を標的とする抗体または融合タンパク質、またはそれらのリガンド；ヒトサイトカイン、増殖因子の抗体、融合タンパク質、または可溶性受容体；インテグリン受容体アンタゴニスト；ポリマー系薬剤；スルファサラジン、メサラミン、ヒドロキシクロロキン、非ステロイド性抗炎症剤（NSAID）；抗増殖薬；細胞傷害性薬物；核移行阻害剤；金製剤；並びにペニシラミン、およびラバマイシンまたはそれらの誘導体から選択され、

該別の治療薬が、請求項1-8のいずれか一項に記載される化合物またはその立体異性体もしくは医薬的に許容される塩の投与に先立って、同時に、または後に投与される、ことを特徴とする治療剤。