

【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7月18日(2013.7.18)

【公表番号】特表2012-528822(P2012-528822A)

【公表日】平成24年11月15日(2012.11.15)

【年通号数】公開・登録公報2012-048

【出願番号】特願2012-513586(P2012-513586)

【国際特許分類】

C 07 D 265/10	(2006.01)
C 07 D 401/10	(2006.01)
C 07 D 403/10	(2006.01)
C 07 D 413/10	(2006.01)
A 61 K 31/535	(2006.01)
A 61 K 31/5355	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 3/10	(2006.01)
A 61 P 3/04	(2006.01)
A 61 P 3/06	(2006.01)
A 61 P 9/12	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 19/10	(2006.01)
A 61 P 27/06	(2006.01)
A 61 P 13/12	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/22	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 15/00	(2006.01)
A 61 P 15/08	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 17/02	(2006.01)
A 61 P 1/18	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)
A 61 P 25/02	(2006.01)
A 61 P 31/12	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 265/10	
C 07 D 401/10	C S P
C 07 D 403/10	
C 07 D 413/10	
A 61 K 31/535	
A 61 K 31/5355	
A 61 K 31/506	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 3/10	
A 61 P 3/04	
A 61 P 3/06	

A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 19/10
A 6 1 P 27/06
A 6 1 P 13/12
A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 25/22
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 15/00
A 6 1 P 15/08
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 17/02
A 6 1 P 1/18
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 25/02
A 6 1 P 31/12
A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成25年5月29日(2013.5.29)

【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

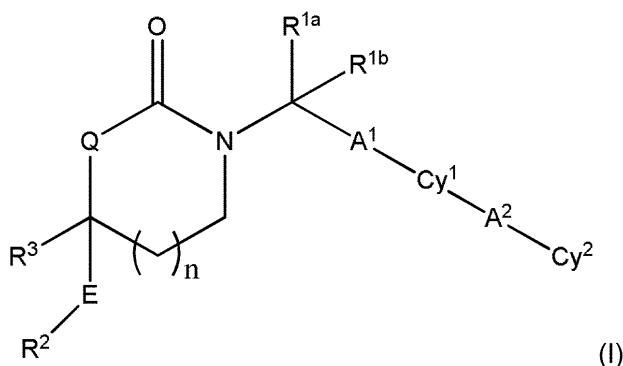
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化67】



[式中、

R^{1a}は、場合により - H、フッ素、シアノ、オキソ、(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、R⁴O-、(R⁴)₂N-、R⁴O₂C-、R⁴S、R⁴S(=O)-、R⁴S(=O)₂-、R⁴C(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=O)-、(R⁴)₂NC(=O)O-、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴-、R⁴OC(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=O)

= N C N) N R ⁴ - 、 (R ⁴ O) ₂ P (= O) O - 、 (R ⁴ O) ₂ P (= O) N R ⁴ - 、 R ⁴ O S (= O) ₂ N R ⁴ - 、 (R ⁴) ₂ N S (= O) ₂ O - 、 (R ⁴) ₂ N S (= O) ₂ N R ⁴ - 、 R ⁴ S (= O) ₂ N R ⁴ - 、 R ⁴ S (= O) ₂ N H C (= O) O - 、 R ⁴ S (= O) ₂ N H C (= O) N R ⁴ - 、 R ⁴ O S (= O) ₂ N H C (= O) - 、 R ⁴ O S (= O) ₂ N H C (= O) O - 、 R ⁴ O S (= O) ₂ N H C (= O) N R ⁴ - 、 (R ⁴) ₂ N S (= O) ₂ N H C (= O) O - 、 (R ⁴) ₂ N S (= O) ₂ N H C (= O) - 、 (R ⁴) ₂ N S (= O) ₂ N H C (= O) O - 、 (R ⁴) ₂ N S (= O) ₂ N H C (= O) N R ⁴ - 、 R ⁴ C (= O) N H S (= O) ₂ - 、 R ⁴ C (= O) N H S (= O) ₂ O - 、 R ⁴ C (= O) N H S (= O) ₂ N R ⁴ - 、 R ⁴ O C (= O) N H S (= O) ₂ - 、 R ⁴ O C (= O) N H S (= O) ₂ N R ⁴ - 、 (R ⁴) ₂ N C (= O) N H S (= O) ₂ - 、 (R ⁴) ₂ N C (= O) N H S (= O) ₂ O - 、 (R ⁴) ₂ N C (= O) N H S (= O) ₂ N R ⁴ - 、 ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリール-アミノ及びヘテロアリールアミノから独立して選択される、4個までの基で置換されている (C₃ - C₇) シクロアルキルであり；

R¹^b は、水素、(C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル又は(C₁ - C₃) アルコキシ(C₁ - C₃) アルキルであり、そして、前記(C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル及び(C₁ - C₃) アルコキシ(C₁ - C₃) アルキル並びにR¹^b により示される基は、-H、フッ素、シアノ、オキソ、(C₁ - C₆) アルキル、ハロ(C₁ - C₆) アルキル、アミノ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキル、R⁴O - 、(R⁴)₂N - 、R⁴O₂C - 、R⁴S、R⁴S(=O) - 、R⁴S(=O)₂ - 、R⁴C(=O)N - 、(R⁴)₂NC(=O) - 、(R⁴)₂NC(=O)O - 、(R⁴)₂NC(=N C N)NR⁴ - 、(R⁴O)₂P(=O)O - 、(R⁴O)₂P(=O)NR⁴ - 、R⁴OS(=O)₂NR⁴ - 、(R⁴)₂NS(=O)₂O - 、(R⁴)₂NS(=O)₂NR⁴ - 、R⁴S(=O)₂NHC(=O) - 、R⁴S(=O)₂NHC(=O)O - 、R⁴S(=O)₂NHC(=O)NR⁴ - 、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O - 、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)NR⁴ - 、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O) - 、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)O - 、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴ - 、R⁴C(=O)NHS(=O)₂O - 、R⁴C(=O)NHS(=O)₂NR⁴ - 、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂- 、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂O - 、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂- 、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂O - 、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂- 、(R⁴)₂NR⁴ - 、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリール-アミノ及びヘテロアリールアミノから独立して選択される、4個までの基で場合により置換されており；

A¹ は、(a) 結合であるか、(b) (C₁ - C₂) アルキレン又はCH₂O(酸素はC_y¹ に結合している) 又はC(=O) であるか、あるいは、(c) (C₂ - C₄) アルキニルであり；

C_y¹ は、アリール、ヘテロアリール、単環式シクロアルキル又は単環式ヘテロシクリルであり、そして、ハロゲン、-CN、-NO₂、-NH₂、-OH、-COOH、(C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₆) シクロアルキル、(C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ(C₃ - C₆) シクロアルキル、ヒドロキシ(C₂ - C₆) アルケニル、ヒドロキシ(C₁ - C₆) アルコキシ、-R⁹、(C₁ - C₆) アルキルチオ、(C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、-SR⁹、-S(=O)R⁶、-S(=O)R⁷、-S(=O)R⁹、-NHR⁶、-N(R⁶)、-C(=O)R⁶、-C(=O)NH₂

、 - S (= O) ₂ NH₂、 - C (= O) NH R⁶、 - C (= O) NR⁶ R⁶、 - C (= O) R⁸、 - S (= O) ₂ NHR⁶、 - S (= O) ₂ N (R⁶) ₂、 - S (= O) ₂ R⁸、 - NH C (= O) R⁶、 - V¹ - NH C (= O) R⁶、 - NHS (= O) ₂ R⁶、 - V¹ - NHS (= O) ₂ R⁶、 - V¹ - C (= O) R⁶、 ヘテロアリール、アリール、ヘテロシクリル、オキソ、 - V¹ - NH₂、 - V¹ - NHR⁶、 - V¹ - N (R⁶) ₂、 - C (= O) R⁷、 - C (= O) NHR⁷、 - C (= O) NR⁶ R⁷、 - C (= O) N (R⁷) ₂、 - S (= O) ₂ NHR⁷、 - S (= O) ₂ NR⁶ R⁷、 - S (= O) ₂ N (R⁷) ₂、シアノ (C₁ - C₆) アルキル、 - V¹ - C (= O) NH₂、 - V¹ - C (= O) NH R⁶、 - V¹ - C (= O) N (R⁶) ₂、 - V¹ - C (= O) NHR⁷、 - V¹ - C (= O) NR⁶ R⁷ 及び - V¹ - C (= O) N (R⁷) ₂ から独立して選択される、1 ~ 4 個の基で場合により置換されており；

A² は、(a) 結合、O、S 若しくはNR⁴ であるか；又は(b) (C₁ - C₃) アルキレン若しくは(C₁ - C₂) アルキレンオキシであり、それぞれ、メチル、エチル、トリフルオロメチル又はオキソから独立して選択される、1 ~ 4 個の基で場合により置換されており；

Cy² は、(a) 水素であるか、又は(b) アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル若しくはヘテロシクリルであり、そして、ハロゲン、 - CN、 - NO₂、 - NH₂、 - OH、 - COOH、 (C₁ - C₆) アルキル、 (C₂ - C₆) アルケニル、 (C₂ - C₆) アルキニル、 (C₁ - C₆) アルコキシ、 (C₃ - C₆) シクロアルキル、 (C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ヒドロキシ (C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ (C₃ - C₆) シクロアルキル、ヒドロキシ (C₂ - C₆) アルケニル、ヒドロキシ (C₁ - C₆) アルコキシ、 - R⁹、 (C₁ - C₆) アルキルチオ、 (C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、 - SR⁹、 - S (= O) R⁶、 - S (= O) R⁷、 - S (= O) R⁹、 - S (= O) ₂ R⁶、 - S (= O) ₂ R⁷、 - S (= O) ₂ R⁹、 - NHR⁶、 - N (R⁶) 、 - C (= O) R⁶、 - C (= O) NH₂、 - S (= O) ₂ NH₂、 - C (= O) NHR⁶、 - C (= O) NR⁶ R⁶、 - C (= O) R⁸、 - S (= O) ₂ NHR⁶、 - S (= O) ₂ N (R⁶) ₂、 - S (= O) ₂ R⁸、 - NH C (= O) R⁶、 - V¹ - NH C (= O) R⁶、 - NH S (= O) ₂ R⁶、 - V¹ - NHS (= O) ₂ R⁶、 - V¹ - C (= O) R⁶、 ヘテロアリール、アリール、ヘテロシクリル、オキソ、 - V¹ - NH₂、 - V¹ - NHR⁶、 - V¹ - N (R⁶) ₂、 - C (= O) R⁷、 - C (= O) NHR⁷、 - C (= O) NR⁶ R⁷、 - C (= O) N (R⁷) ₂、 - S (= O) ₂ NHR⁷、 - S (= O) ₂ NR⁶ R⁷、 - S (= O) ₂ N (R⁷) ₂、シアノ (C₁ - C₆) アルキル、 - V¹ - C (= O) NH₂、 - V¹ - C (= O) NHR⁶、 - V¹ - C (= O) NR⁶ R⁷ 及び - V¹ - C (= O) N (R⁷) ₂ から独立して選択される、1 ~ 4 個の基で場合により置換されており；

E は、(a) 結合であるか、又は(b) (C₁ - C₃) アルキレン若しくは(C₁ - C₂) アルキレニルオキシ(式中、O はR² に結合している)であり、それぞれ、メチル、エチル、トリフルオロメチル又はオキソから独立して選択される、1 ~ 4 個の基で場合により置換されており；

R² は、(C₁ - C₆) アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又はヘテロシクリルであり、そして、ハロゲン、 - CN、 - NO₂、 - NH₂、 - OH、 - COOH、 (C₁ - C₆) アルキル、 (C₂ - C₆) アルケニル、 (C₂ - C₆) アルキニル、 (C₁ - C₆) アルコキシ、 (C₃ - C₆) シクロアルキル、 (C₃ - C₆) シクロアルコキシ、ヒドロキシ (C₁ - C₆) アルキル、ヒドロキシ (C₃ - C₆) シクロアルキル、ヒドロキシ (C₂ - C₆) アルケニル、ヒドロキシ (C₁ - C₆) アルコキシ、 - R⁹、 (C₁ - C₆) アルキルチオ、 (C₃ - C₆) シクロアルキルチオ、 - SR⁹、 - S (= O) R⁶、 - S (= O) R⁷、 - S (= O) R⁹、 - S (= O) ₂ R⁶、 - S (= O) ₂ R⁷、 - S (= O) ₂ R⁹、 - NHR⁶、 - N (R⁶) 、 - C (= O) R⁶、 - C (= O) NH₂、 - S (= O) ₂ NH₂、 - C (= O) NHR⁶、 - C (= O) NR⁶ R⁶、 - C (= O) R⁸、 - S (= O) ₂ NHR⁶、 - S (= O) ₂ N (R⁶) ₂、 - S (= O)

O) ₂ R⁸、-NHC(=O)R⁶、-V¹-NHC(=O)R⁶、-NHS(=O)₂
 R⁶、-V¹-NHS(=O)₂R⁶、-V¹-C(=O)R⁶、ヘテロアリール、アリ
 ール、ヘテロシクリル、オキソ、-V¹-NH₂、-V¹-NHR⁶、-V¹-N(R⁶)₂、
 -C(=O)R⁷、-C(=O)NHR⁷-C(=O)NR⁶R⁷、-C(=O)
 N(R⁷)₂、-S(=O)₂NHR⁷、-S(=O)₂NR⁶R⁷、-S(=O)₂N
 (R⁷)₂、シアノ(C₁-C₆)アルキル、-V¹-C(=O)NH₂、-V¹-C(=O)
 =O)NHR⁶、-V¹-C(=O)N(R⁶)₂、-V¹-C(=O)NHR⁷、-V
¹-C(=O)NR⁶R⁷及び-V¹-C(=O)N(R⁷)₂から独立して選択され
 る、4個までの基で場合により置換されており；

R^3 は、(C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル、(C₃ - C₅)シクロアルキル(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルコキシ又は(C₁ - C₃)アルコキシ(C₁ - C₃)アルキルから選択され、そして、-H、フッ素、シアノ、オキソ、(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、アミノ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ジ(C₁ - C₆)アルキルアミノ(C₁ - C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキル、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、R⁴O-、(R⁴)₂N-、R⁴O₂C-、R⁴C(=O)O-、R⁴S-、R⁴S(=O)-、R⁴S(=O)₂-、R⁴C(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=O)O-、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴-、R⁴OC(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NC(=N)CN)NR⁴-、(R⁴O)₂P(=O)O-、(R⁴O)₂P(=O)NR⁴-、R⁴OS(=O)₂NR⁴-、(R⁴)₂NS(=O)₂O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NR⁴-、R⁴S(=O)₂NR⁴-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴S(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)O-、R⁴OS(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)O-、(R⁴)₂NS(=O)₂NHC(=O)NR⁴-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂O-、R⁴C(=O)NHS(=O)₂NR⁴-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂O-、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂NR⁴-、スピロシクロアルキル；ヘテロシクリル（これはアルキル、ハロアルキル、ハロゲン又はオキソで場合により置換されている）、ヘテロアリール（これはアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、CO₂H、CONH₂、N-モノアルキル置換アミド、N,N-ジアルキル置換アミド又はオキソで場合により置換されている）、アリールアミノ（これはアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、CO₂H、CONH₂、N-モノアルキル置換アミド及びN,N-ジアルキル置換アミドで場合により置換されていてもよい）及びヘテロアリールアミノ（これはアルキル、ハロアルキル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルホニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、ジアルキルアミノ、ニトロ、シアノ、CO₂H、CONH₂、N-モノアルキル置換アミド、N,N-ジアルキル置換アミド又はオキソで場合により置換されている）から独立して選択される、4個までの基で場合により置換されており；

n は、0、1 又は 2 であり；

Q は、 O、 CH₂ 又は NR⁵ であり；

各 R⁴ は、H、(C₁-C₆)アルキル、ハロ(C₁-C₆)アルキル、アミノ(C₁-C₆)アルキル、(C₁-C₆)アルキルアミノ(C₁-C₆)アルキル、ジ(C₁-C₆)アルキルアミノ(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₁-C₆)アルキル及び(C₁-C₆)アルコキシ(C₁-C₆)アルキルから独立して選択され；

各 R⁵ は、独立して、H、(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル又はヒドロキシ(C₁ - C₆)アルキルであり；

各 R⁶ は、独立して、(C₁ - C₆)アルキル、(C₂ - C₆)アルケニル、(C₂ - C₆)アルキニル又は(C₁ - C₆)アルコキシであり；

V¹ は、(C₁ - C₆)アルキレン、(C₁ - C₆)アルケニレン、(C₁ - C₆)アルキニレン又は(C₁ - C₆)アルキレンオキシであり；

各 R⁷ は、独立して、(C₃ - C₆)シクロアルキル又は(C₃ - C₆)シクロアルコキシであり；

R⁸ は、ヘテロシクリルであり；そして、

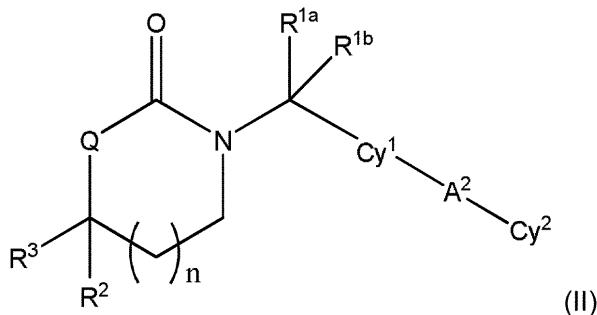
R⁹ は、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル又はハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキルである]

で示される化合物又はその薬学的に許容し得る塩、エナンチオマー若しくはジアステレオマー。

【請求項 2】

構造式(I I)：

【化 6 8】



[式中、

R¹^a は、場合により置換されている(C₃ - C₅)シクロアルキルであり；

R¹^b は、水素又は場合により置換されている(C₁ - C₆)アルキルであり；そして

、 Cy² は、場合により置換されている、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル又はヘテロシクリル基である]

により示される請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容し得る塩、エナンチオマー若しくはジアステレオマー。

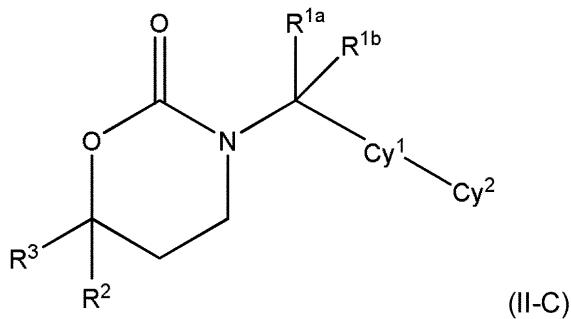
【請求項 3】

Cy¹ が、場合により置換されている、シクロヘキシリル、ピペリジニル、ピロリジニル、フェニル、ナフチル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、チアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、フリル、チエニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリダジニル又はトリアゾロピリジニル基である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

構造式(I I - C)：

【化71】



により示される請求項3に記載の化合物又はその薬学的に許容し得る塩、エナンチオマー若しくはジアステレオマー。

【請求項5】

Cy²が、場合により置換されている、フェニル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、チアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサジアゾリル、チアシアゾリル、トリアゾリル、フリル、チエニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリダジニル、トリアゾロピリジニル、オキソジヒドロピリジル、オキソジヒドロピリダジニル、オキソジヒドロピリミジニル、オキソジヒドロピラジニル、オキソインドリニル、オキソジヒドロキノリニル、オキソジヒドロピロロピリジニル又はオキソジヒドロトリアゾロピリジニル基である、請求項4に記載の化合物。

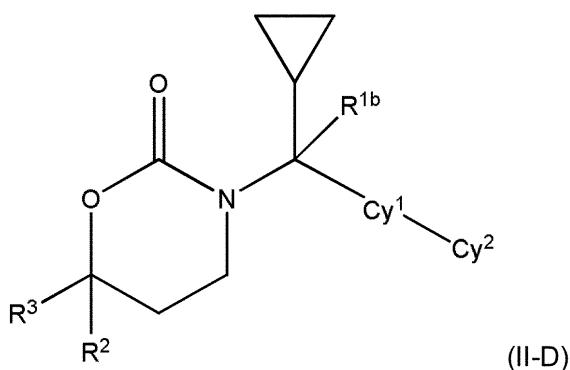
【請求項6】

R^{1b}が、水素又は場合により置換されているメチルである、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

構造式(I I - D) :

【化72】



により示される請求項6に記載の化合物又はその薬学的に許容し得る塩、エナンチオマー若しくはジアステレオマー。

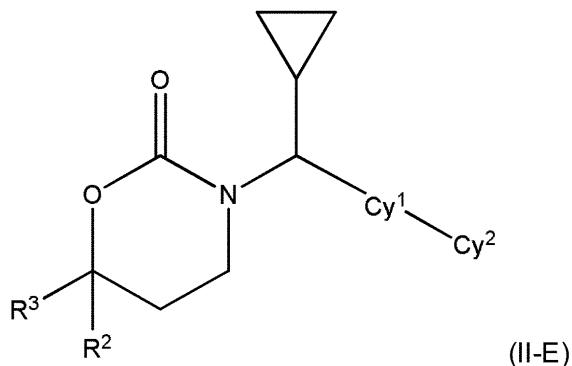
【請求項8】

Cy¹が、場合により置換されているフェニルである、請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

構造式(I I - E) :

【化73】



により示される請求項8に記載の化合物又はその薬学的に許容し得る塩、エナンチオマー若しくはジアステレオマー。

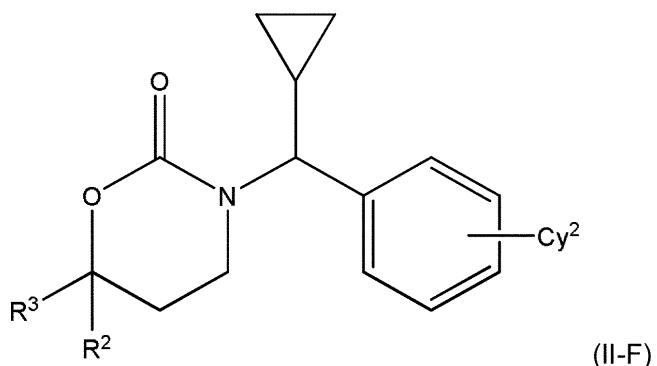
【請求項10】

Cy²が、場合により置換されているオキソジヒドロピリジルである、請求項9に記載の化合物。

【請求項11】

構造式（II-F）：

【化74】



により示される請求項10に記載の化合物又はその薬学的に許容し得る塩、エナンチオマー若しくはジアステレオマー。

【請求項12】

R³が、(C₃-C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₂-C₅)アルキル、シアノ(C₂-C₅)アルキル、ジヒドロキシ(C₃-C₅)アルキル、-H₂NCO(C₁-C₅)アルキル、(C₁-C₂)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル、H₂NSO₂O(C₂-C₅)アルキル、H₂NSO₂NH(C₂-C₅)アルキル、オキソ(C₂-C₅)アルキル、MeC(=O)NH(C₂-C₅)アルキル、MeSO₂NH(C₂-C₅)アルキル又はMeSO₂NH(C₂-C₅)アルキルである、請求項1~11のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項13】

R²が、場合により置換されている、(C₁-C₆)アルキル、アリール、ヘテロアリール又はシクロアルキル基であり；それぞれ、ハロゲン、-CN、-NO₂、-NH₂、-OH、-COOH、(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)アルキニル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₃-C₆)シクロアルコキシ、ヒドロキシ(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₃-C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₂-C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₁-C₆)アルコキシ、(C₄-C₇)シクロアルキルアルキル、(C₄-C₇)シクロアルキルアル

コキシ、(C₃ - C₆)シクロアルキル(C₂ - C₄)アルキニル、ハロ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₂ - C₆)アルケニル、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₃ - C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄ - C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルコキシ、(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキル、ハロ(C₁ - C₆)アルコキシ(C₁ - C₆)アルキルチオ及び(C₃ - C₆)シクロアルキルチオから独立して選択される、4個までの基で場合により置換されており；

R³が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ビニル、アリル又はエトキシエチルであり、それぞれ、メチル、HO-、MeO-、H₂N-、MeC(=O)NH-、MeS(=O)₂NH-、H₂NC(=O)-、MeNHC(=O)-、HO₂C-、(HO)₂P(=O)O-、H₂NS(=O)₂O-、H₂NS(=O)₂NH-、MeNHC(=O)NH-、MeNHC(=O)O-、オキソ、シアノ、HO₂C-、HOCH₂CH₂NH-、4-モルホリノ、HOCH₂C(=O)NH-、H₂NCH₂C(=O)NH-、EtNHC(=O)NH、MeOC(=O)NH-、MeNHC(=NC₂N)NH-、MeS-、MeSO₂-、MeSO₂N(Me)-、MeS(=O)₂NHC(=O)-、イミダゾリルアミノ-、イミダゾリル、テトラゾリル、スピロシクロプロピル、FC₂CH₂NH、1-ピロリジニル、3-フルオロ-1-ピロリジニル、3-オキソ-1-ピペラジニル、1-アゼチジニル、1,1-ジオキソ-2-イソチアゾリジニル、2-オキソ-1-ピロリジニル、H₂NCONH-、H₂NCO₂-、HOCH₂CH₂O-、MeNH-、Me₂N-及びMeCONMeから独立して選択される、2個までの基で場合により置換されている、請求項1～12のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項14】

R²が、場合により(C₁ - C₄)アルキル、(C₁ - C₄)アルコキシ、(C₁ - C₄)ハロアルキル、(C₁ - C₄)ハロアルコキシ、ハロゲン及びシアノから独立して選択される、1～3個の基で置換されているフェニルであり；

R³が、2-メチルアリル、MeSO₂NHCH₂CH₂CH₂、H₂NC(=O)CH₂CH₂、H₂NC(=O)CM₂CH₂、3-ヒドロキシプロピル、3-ヒドロキシ-3-メチルブチル、2-ヒドロキシエチル、2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル又は2-シアノ-2-メチルプロピルであり；

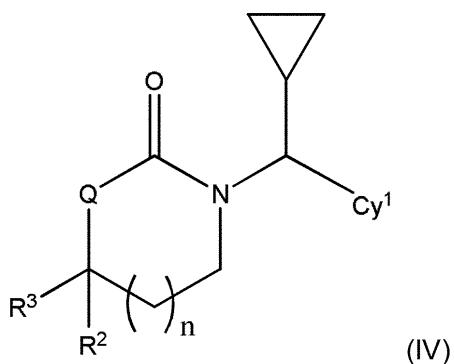
Cy¹により示される基が、ハロ、メチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、メトキシ、メトキシカルボニル、カルボキシ、エトキシカルボニルメトキシ、2-ヒドロキシ-2-メチルプロポキシ、シアノ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシ、t-ブトキシカルボニル、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、2-ヒドロキシ-2-プロピル、メトキシメチル、メチルスルホニル、メチルスルホニルアミノ、N-メチル-メチルスルホニルアミノ及びベンジルオキシカルボニルから独立して選択される、1～4個の基で場合により置換されており；そして、

Cy²により示される基が、メチル、エチル、プロピル、シクロプロピル、ハロ、ヒドロキシ、メトキシ、ヒドロキシメチル、メトキシカルボニル、アミノ、シアノ、カルバモイル、メチル-カルバモイル、ジメチルカルバモイル、メチルスルホニル、メチルスルホニルアミノ、N-メチル-メチルスルホニルアミノ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2-フルオロエチル、アセチル、1-ヒドロキシエチル、2-ヒドロキシエチル及び2-ヒドロキシ-2-プロピルから独立して選択される、1～4個の基で場合により置換されている、請求項1～13のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項15】

構造式(IV)：

【化79】



により示される請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容し得る塩、エナンチオマー若しくはジアステレオマー。

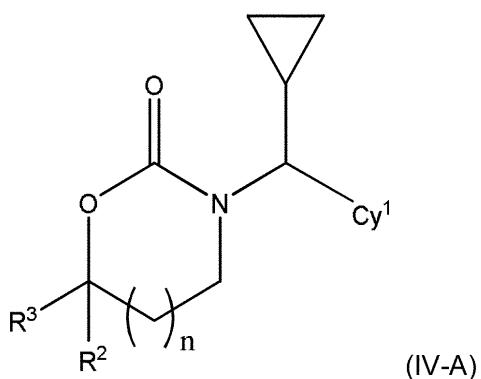
【請求項16】

Cy^1 が、場合により置換されている、シクロヘキシリル、ペベリジニル、ピロリジニル、フェニル、ナフチル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、チアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、ピラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、トリアゾリル、フリル、チエニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾトリアゾリル、ベンゾチアゾリル、イミダゾピリダジニル又はトリアゾロピリジニル基である、請求項15に記載の化合物。

【請求項17】

構造式(IV-A)：

【化80】

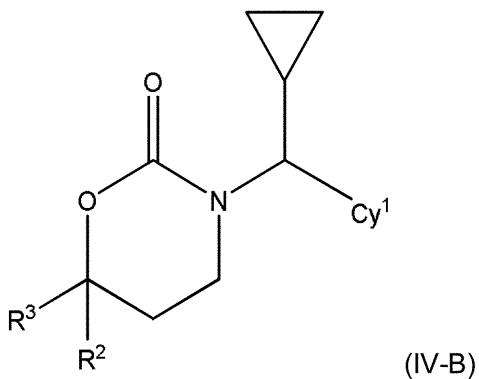


により示される請求項16に記載の化合物又はその薬学的に許容し得る塩、エナンチオマー若しくはジアステレオマー。

【請求項18】

構造式(IV-B)：

【化81】



により示される請求項17に記載の化合物又はその薬学的に許容し得る塩、エナンチオマー若しくはジアステレオマー。

【請求項19】

Cy¹が、場合により置換されているフェニルである、請求項18に記載の化合物。

【請求項20】

R³が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ビニル、アリル又はエトキシエチルであり、それぞれ、メチル、HO-、MeO-、H₂N-、MeC(=O)NH-、MeS(=O)₂NH-、H₂NC(=O)-、MeNHC(=O)-、HO₂C-、(HO)₂P(=O)O-、H₂NS(=O)₂O-、H₂NS(=O)₂NH-、MeNHC(=O)NH-、MeNHC(=O)O-、オキソ、シアノ、HO₂C-、HOCH₂CH₂NH-、4-モルホリノ、HOCH₂C(=O)NH-、H₂NCH₂C(=O)NH-、EtNHC(=O)NH、MeOC(=O)NH-、MeNHC(=NCN)NH-、MeS-、MeSO₂-、-MeSO₂N(Me)-、MeS(=O)₂NHC(=O)-、イミダゾリルアミノ-、イミダゾリル、テトラゾリル、スピロシクロプロピル、FC₂CH₂NH、1-ピロリジニル、3-フルオロ-1-ピロリジニル、3-オキソ-1-ピペラジニル、1-アゼチジニル、1,1-ジオキソ-2-イソチアゾリジニル、2-オキソ-1-ピロリジニル、H₂NCONH-、H₂NCO₂-、HOCH₂CH₂O-、MeNH-、Me₂N-及びMeCONMeから独立して選択される、2個までの基で場合により置換されている、請求項15～19のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項21】

R²が、場合により置換されている、(C₁-C₆)アルキル、アリール、ヘテロアリール又はシクロアルキル基であり；それぞれ、ハロゲン、-CN、-NO₂、-NH₂、-OH、-COOH、(C₁-C₆)アルキル、(C₂-C₆)アルケニル、(C₂-C₆)アルキニル、(C₁-C₆)アルコキシ、(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₃-C₆)シクロアルコキシ、ヒドロキシ(C₁-C₆)アルキル、ヒドロキシ(C₃-C₆)シクロアルキル、ヒドロキシ(C₂-C₆)アルケニル、ヒドロキシ(C₁-C₆)アルコキシ、(C₄-C₇)シクロアルキルアルキル、(C₄-C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₃-C₆)シクロアルキル(C₂-C₄)アルキニル、ハロ(C₁-C₆)アルキル、ハロ(C₂-C₆)アルケニル、ハロ(C₃-C₆)シクロアルキル、ハロ(C₄-C₇)シクロアルキルアルキル、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ、ハロ(C₃-C₆)シクロアルコキシ、ハロ(C₄-C₇)シクロアルキルアルコキシ、(C₁-C₆)アルコキシ(C₁-C₆)アルコキシ、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ(C₁-C₆)アルコキシ、(C₁-C₆)アルコキシ(C₁-C₆)アルキル、ハロ(C₁-C₆)アルコキシ(C₁-C₆)アルキルチオ、(C₃-C₆)シクロアルキルチオから独立して選択される、4個までの基で場合により置換されており；

R³が、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ビニル、アリル又はエトキシエチルであり、それぞれ、メチル、HO-、MeO-、H₂N-、MeC(=O)NH-、MeS(=O)₂NH-、MeS-、MeSO₂-、-MeSO₂N(Me)-、MeS(=O)₂NHC(=O)-、イミダゾリルアミノ-、イミダゾリル、テトラゾリル、スピロシクロプロピル、FC₂CH₂NH、1-ピロリジニル、3-フルオロ-1-ピロリジニル、3-オキソ-1-ピペラジニル、1-アゼチジニル、1,1-ジオキソ-2-イソチアゾリジニル、2-オキソ-1-ピロリジニル、H₂NCONH-、H₂NCO₂-、HOCH₂CH₂O-、MeNH-、Me₂N-及びMeCONMeから独立して選択される、2個までの基で場合により置換されている、請求項15～19のいずれか一項に記載の化合物。

$= O)_2 NH -$ 、 $H_2 NC(=O) -$ 、 $Me NH C(=O) -$ 、 $HO_2 C -$ 、 $(HO)_2 P(=O)O -$ 、 $H_2 NS(=O)_2 O -$ 、 $H_2 NS(=O)_2 NH -$ 、 $Me NH C(=O) NH -$ 、 $Me NH C(=O) O -$ 、オキソ、シアノ、 $HO_2 C -$ 、 $HOCH_2 CH_2 NH -$ 、4-モルホリノ、 $HOCH_2 C(=O) NH -$ 、 $H_2 NCH_2 C(=O) NH -$ 、 $E t NH C(=O) NH$ 、 $MeOC(=O) NH -$ 、 $Me NH C(=NC) NH -$ 、 $MeS -$ 、 $MeSO_2 -$ 、 $-MeSO_2 N(Me) -$ 、 $MeS(=O)_2 NH C(=O) -$ 、イミダゾリルアミノ-、イミダゾリル、テトラゾリル、スピロシクロプロピル、 $FC H_2 CH_2 NH$ 、1-ピロリジニル、3-フルオロ-1-ピロリジニル、3-オキソ-1-ピペラジニル、1-アゼチジニル、1,1-ジオキソ-2-イソチアゾリジニル、2-オキソ-1-ピロリジニル、 $H_2 NCONH -$ 、 $H_2 NCO_2 -$ 、 $HOCH_2 CH_2 O -$ 、 $Me NH -$ 、 $Me_2 N -$ 及び $MeCONMe$ から独立して選択される、2個までの基で場合により置換されている、請求項15～19のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項22】

R^2 が、フェニル又はフルオロフェニルであり；

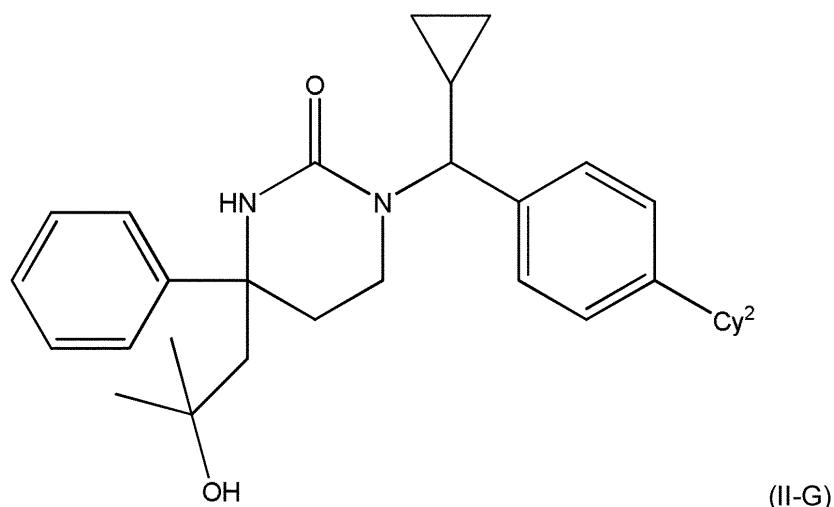
R^3 が、2-メチルアリル、2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル又は2-シアノ-2-メチルプロピルであり；そして、

Cy^1 により示される基が、フルオロ、クロロ、ブロモ、メチル、エチル、シクロプロピル、 $OCHF_2$ 又は CF_3 で場合により置換されている、請求項15～21のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項23】

構造式(I I - G)：

【化82】



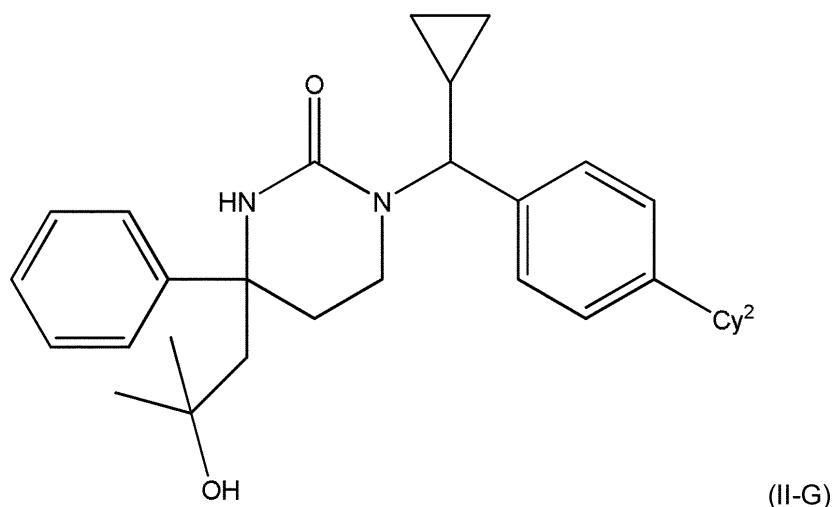
[式中、 Cy^2 は、場合によりメチル、シクロプロピル、シアノ、 $CONH_2$ 、 $CONHMe$ 又は $CONMe_2$ で置換されている、ピリジル、ピリダジニル又はピリミジニル基である]

により示される請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容し得る塩、エナンチオマー若しくはジアステレオマー。

【請求項24】

構造式(I I - G)：

【化 8 3】



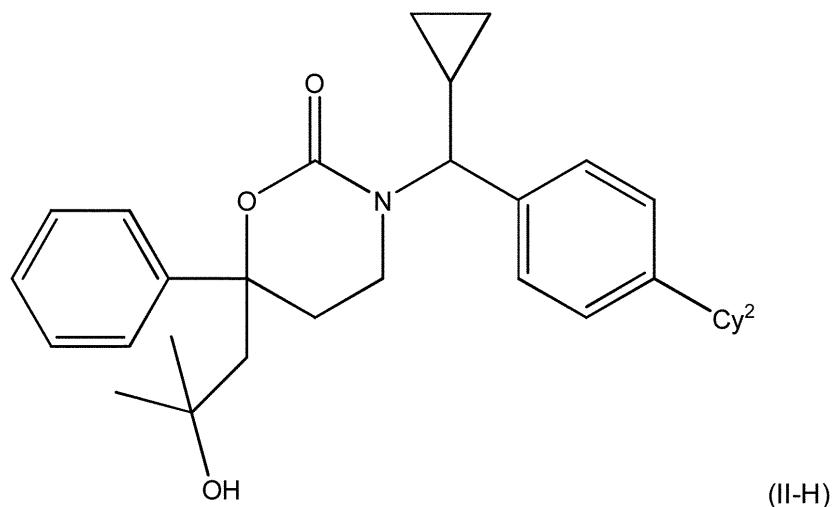
[式中、Cy²は、場合によりメチル、エチル、プロピル、イソプロピル又はシクロプロピルで環窒素が置換されているオキソジヒドロピリジル基である]

により示される請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容し得る塩、エナンチオマー若しくはジアステレオマー。

【請求項25】

構造式(II-H)：

【化84】



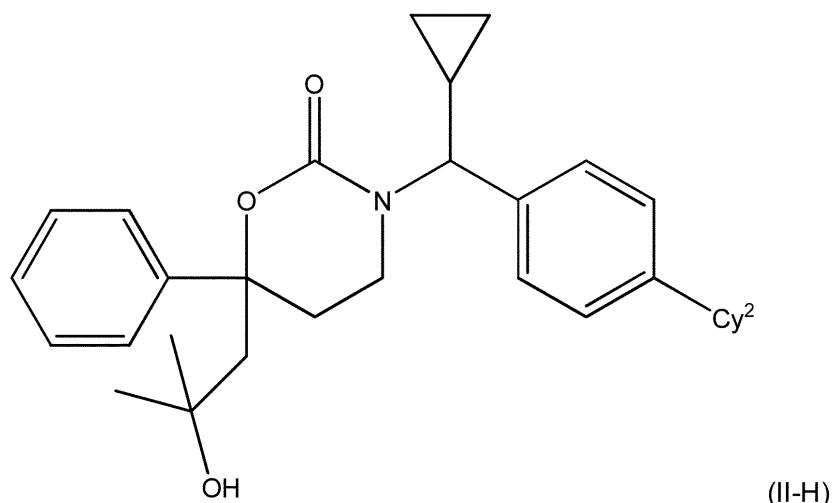
[式中、Cy²は、場合によりメチル、シクロプロピル、シアノ、CONH₂、CONHMe又はCONMe₂で置換されている、ピリジル、ピリダジニル又はピリミジニル基である]

により示される請求項1に記載の化合物又はその薬学的に許容し得る塩、エナンチオマー若しくはジアステレオマー。

【請求項26】

構造式(II-I)：

【化 8 5】



[式中、 Cy^2 は、場合によりメチル、エチル、プロピル、イソプロピル又はシクロプロピルで環窒素が置換されているオキソジヒドロピリジル基である]

により示される請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容し得る塩、エナンチオマー若しくはジアステレオマー。

【請求項 2 7】

1 1 - H S D 1 の活性又は発現に関連する疾患を有する対象を処置するための、請求項 1 ~ 2 6 のいずれか一項に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 2 8】

i) 薬学的に許容し得る担体又は希釈剤；及び ii) 請求項 1 ~ 2 6 のいずれか一項に記載の化合物；又はその薬学的に許容し得る塩、エナンチオマー若しくはジアステレオマーを含む、医薬組成物。