

【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 0 7 D 265/10 (2006.01)

C 0 7 D 401/10 (2006.01)

C 0 7 D 403/10 (2006.01)

C 0 7 D 413/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/535 (2006.01)

A 6 1 K 31/5355 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 265/10

C 0 7 D 401/10 C S P

C 0 7 D 403/10

C 0 7 D 413/10

A 6 1 K 31/535

A 6 1 K 31/5355

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 3/04

A 6 1 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

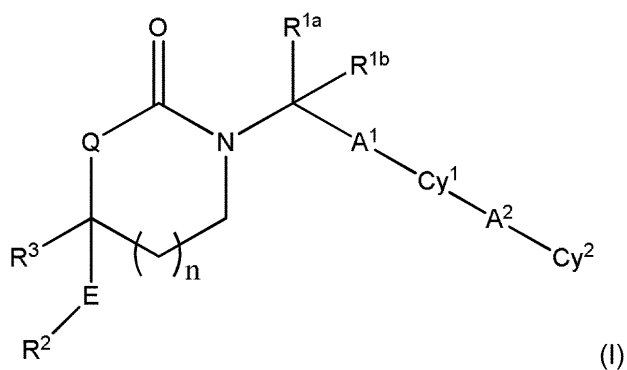
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 6 7】



[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
 、 R^4O- 、(R^4)₂N-、 R^4O_2C- 、 R^4S 、 $R^4S(=O)-$ 、 $R^4S(=O)$
 $)_2-$ 、 $R^4C(=O)NR^4-$ 、(R^4)₂NC(=O)-、(R^4)₂NC(=O)
 O-、(R^4)₂NC(=O)NR⁴-、 $R^4OC(=O)NR^4-$ 、(R^4)₂NC(

= NCN) 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) -、(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 -、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂ -、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂O -、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂NR⁴ -、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂ -、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂O -、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)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個までの基で置換されている(C₃-C₇)シクロアルキルであり；

R^{1b}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R^{1b}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)NR⁴ -、(R⁴)₂NC(=O) -、(R⁴)₂NC(=O)O -、(R⁴)₂NC(=O)NR⁴ -、R⁴OC(=O)NR⁴ -、(R⁴)₂NC(=NCN)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) -、(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 -、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂ -、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂O -、R⁴OC(=O)NHS(=O)₂NR⁴ -、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂ -、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)₂O -、(R⁴)₂NC(=O)NHS(=O)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Cy¹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；

Cy¹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、-S(=O)₂R⁶、-S(=O)₂R⁷、-S(=O)₂R⁹、-NHR⁶、-N(R⁶)、-C(=O)R⁶、-C(=O)NH₂

、 $-S(=O)_2NH_2$ 、 $-C(=O)NHR^6$ 、 $-C(=O)NR^6R^6$ 、 $-C(=O)R^8$ 、 $-S(=O)_2NHR^6$ 、 $-S(=O)_2N(R^6)_2$ 、 $-S(=O)_2R^8$ 、 $-NHC(=O)R^6$ 、 $-V^1-NHC(=O)R^6$ 、 $-NHS(=O)_2R^6$ 、 $-V^1-NHS(=O)_2R^6$ 、 $-V^1-C(=O)R^6$ 、ヘテロアリール、アリール、ヘテロシクリル、オキソ、 $-V^1-NH_2$ 、 $-V^1-NHR^6$ 、 $-V^1-N(R^6)_2$ 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-C(=O)NHR^7$ 、 $-C(=O)NR^6R^7$ 、 $-C(=O)N(R^7)_2$ 、 $-S(=O)_2NHR^7$ 、 $-S(=O)_2NR^6R^7$ 、 $-S(=O)_2N(R^7)_2$ 、シアノ(C_1-C_6)アルキル、 $-V^1-C(=O)NH_2$ 、 $-V^1-C(=O)NHR^6$ 、 $-V^1-C(=O)N(R^6)_2$ 、 $-V^1-C(=O)NHR^7$ 、 $-V^1-C(=O)NR^6R^7$ 及び $-V^1-C(=O)N(R^7)_2$ 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)(C_1-C_3)アルキレン若しくは(C_1-C_2)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、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-OH$ 、 $-COOH$ 、(C_1-C_6)アルキル、(C_2-C_6)アルケニル、(C_2-C_6)アルキニル、(C_1-C_6)アルコキシ、(C_3-C_6)シクロアルキル、(C_3-C_6)シクロアルコキシ、ヒドロキシ(C_1-C_6)アルキル、ヒドロキシ(C_3-C_6)シクロアルキル、ヒドロキシ(C_2-C_6)アルケニル、ヒドロキシ(C_1-C_6)アルコキシ、 $-R^9$ 、(C_1-C_6)アルキルチオ、(C_3-C_6)シクロアルキルチオ、 $-SR^9$ 、 $-S(=O)R^6$ 、 $-S(=O)R^7$ 、 $-S(=O)R^9$ 、 $-S(=O)_2R^6$ 、 $-S(=O)_2R^7$ 、 $-S(=O)_2R^9$ 、 $-NHR^6$ 、 $-N(R^6)$ 、 $-C(=O)R^6$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、 $-C(=O)NHR^6$ 、 $-C(=O)NR^6R^6$ 、 $-C(=O)R^8$ 、 $-S(=O)_2NHR^6$ 、 $-S(=O)_2N(R^6)_2$ 、 $-S(=O)_2R^8$ 、 $-NHC(=O)R^6$ 、 $-V^1-NHC(=O)R^6$ 、 $-NHS(=O)_2R^6$ 、 $-V^1-NHS(=O)_2R^6$ 、 $-V^1-C(=O)R^6$ 、ヘテロアリール、アリール、ヘテロシクリル、オキソ、 $-V^1-NH_2$ 、 $-V^1-NHR^6$ 、 $-V^1-N(R^6)_2$ 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-C(=O)NHR^7$ 、 $-C(=O)NR^6R^7$ 、 $-C(=O)N(R^7)_2$ 、 $-S(=O)_2NHR^7$ 、 $-S(=O)_2NR^6R^7$ 、 $-S(=O)_2N(R^7)_2$ 、シアノ(C_1-C_6)アルキル、 $-V^1-C(=O)NH_2$ 、 $-V^1-C(=O)NHR^6$ 、 $-V^1-C(=O)N(R^6)_2$ 、 $-V^1-C(=O)NHR^7$ 、 $-V^1-C(=O)NR^6R^7$ 及び $-V^1-C(=O)N(R^7)_2$ 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)(C_1-C_3)アルキレン若しくは(C_1-C_2)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、(C_1-C_6)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、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-OH$ 、 $-COOH$ 、(C_1-C_6)アルキル、(C_2-C_6)アルケニル、(C_2-C_6)アルキニル、(C_1-C_6)アルコキシ、(C_3-C_6)シクロアルキル、(C_3-C_6)シクロアルコキシ、ヒドロキシ(C_1-C_6)アルキル、ヒドロキシ(C_3-C_6)シクロアルキル、ヒドロキシ(C_2-C_6)アルケニル、ヒドロキシ(C_1-C_6)アルコキシ、 $-R^9$ 、(C_1-C_6)アルキルチオ、(C_3-C_6)シクロアルキルチオ、 $-SR^9$ 、 $-S(=O)R^6$ 、 $-S(=O)R^7$ 、 $-S(=O)R^9$ 、 $-S(=O)_2R^6$ 、 $-S(=O)_2R^7$ 、 $-S(=O)_2R^9$ 、 $-NHR^6$ 、 $-N(R^6)$ 、 $-C(=O)R^6$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、 $-C(=O)NHR^6$ 、 $-C(=O)NR^6R^6$ 、 $-C(=O)R^8$ 、 $-S(=O)_2NHR^6$ 、 $-S(=O)_2N(R^6)_2$ 、 $-S(=$

$O)_2 R^8$ 、 $-NHC(=O)R^6$ 、 $-V^1-NHC(=O)R^6$ 、 $-NHS(=O)_2$
 R^6 、 $-V^1-NHS(=O)_2 R^6$ 、 $-V^1-C(=O)R^6$ 、ヘテロアリール、アリー
 ル、ヘテロシクリル、オキソ、 $-V^1-NH_2$ 、 $-V^1-NHR^6$ 、 $-V^1-N(R^6)$
 $_2$ 、 $-C(=O)R^7$ 、 $-C(=O)NHR^7$ 、 $-C(=O)NR^6 R^7$ 、 $-C(=O)$
 $N(R^7)_2$ 、 $-S(=O)_2 NHR^7$ 、 $-S(=O)_2 NR^6 R^7$ 、 $-S(=O)_2 N$
 $(R^7)_2$ 、シアノ(C_1-C_6)アルキル、 $-V^1-C(=O)NH_2$ 、 $-V^1-C(=O)$
 NHR^6 、 $-V^1-C(=O)N(R^6)_2$ 、 $-V^1-C(=O)NHR^7$ 、 $-V$
 $^1-C(=O)NR^6 R^7$ 及び $-V^1-C(=O)N(R^7)_2$ 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、(C_1-C_6)アルキル、(C_2-C_6)アルケニル、(C_2-C_6)アルキ
 ニル、(C_3-C_5)シクロアルキル(C_1-C_4)アルキル、(C_1-C_3)アルコキ
 シ(C_1-C_3)アルコキシ又は(C_1-C_3)アルコキシ(C_1-C_3)アルキルから
 選択され、そして、 $-H$ 、フッ素、シアノ、オキソ、(C_1-C_6)アルキル、ハロ(C
 $_1-C_6$)アルキル、アミノ(C_1-C_6)アルキル、(C_1-C_6)アルキルアミノ(C
 $_1-C_6$)アルキル、ジ(C_1-C_6)アルキルアミノ(C_1-C_6)アルキル、ヒド
 ロキシ(C_1-C_6)アルキル、(C_1-C_6)アルコキシ(C_1-C_6)アルキル、 R
 $^4 O-$ 、(R^4) $_2 N-$ 、 $R^4 O_2 C-$ 、 $R^4 C(=O)O-$ 、 $R^4 S-$ 、 $R^4 S(=O)$
 $-$ 、 $R^4 S(=O)_2-$ 、 $R^4 C(=O)NR^4-$ 、(R^4) $_2 NC(=O)-$ 、(R
 4) $_2 NC(=O)O-$ 、(R^4) $_2 NC(=O)NR^4-$ 、 $R^4 OC(=O)NR^4-$
 、(R^4) $_2 NC(=NCN)NR^4-$ 、($R^4 O$) $_2 P(=O)O-$ 、($R^4 O$) $_2 P$
 $(=O)NR^4-$ 、 $R^4 OS(=O)_2 NR^4-$ 、(R^4) $_2 NS(=O)_2 O-$ 、(R
 4) $_2 NS(=O)_2 NR^4-$ 、 $R^4 S(=O)_2 NR^4-$ 、 $R^4 S(=O)_2 NHC(=O)$
 $-$ 、 $R^4 S(=O)_2 NHC(=O)O-$ 、 $R^4 S(=O)_2 NHC(=O)NR^4-$ 、 $R^4 OS(=O)_2$
 $NHC(=O)-$ 、 $R^4 OS(=O)_2 NHC(=O)O-$ 、 $R^4 OS(=O)_2 NHC(=O)O-$ 、
 $R^4 OS(=O)_2 NHC(=O)NR^4-$ 、(R^4) $_2 NS(=O)_2 NHC(=O)$
 $-$ 、(R^4) $_2 NS(=O)_2 NHC(=O)O-$ 、(R^4) $_2 NS(=O)_2 NHC(=O)$
 $(=O)NR^4-$ 、 $R^4 C(=O)NHS(=O)_2-$ 、 $R^4 C(=O)NHS(=O)_2$
 $O-$ 、 $R^4 C(=O)NHS(=O)_2 NR^4-$ 、 $R^4 OC(=O)NHS(=O)_2-$
 、 $R^4 OC(=O)NHS(=O)_2 O-$ 、 $R^4 OC(=O)NHS(=O)_2 NR^4-$
 、(R^4) $_2 NC(=O)NHS(=O)_2-$ 、(R^4) $_2 NC(=O)NHS(=O)_2$
 $O-$ 、(R^4) $_2 NC(=O)NHS(=O)_2 NR^4-$ 、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、 $CO_2 H$ 、 $CONH_2$ 、 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、 $CO_2 H$ 、 $CONH_2$ 、 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、 $CO_2 H$ 、 C
 ONH_2 、 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 、 CH_2 又は NR^5 であり；

各 R^4 は、 H 、(C_1-C_6)アルキル、ハロ(C_1-C_6)アルキル、アミノ(C_1
 $-C_6$)アルキル、(C_1-C_6)アルキルアミノ(C_1-C_6)アルキル、ジ(C_1-
 C_6)アルキルアミノ(C_1-C_6)アルキル、ヒドロキシ(C_1-C_6)アルキル及び
 (C_1-C_6)アルコキシ(C_1-C_6)アルキルから独立して選択され；

各 R^5 は、独立して、 H 、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキル又はヒドロキシ $(C_1 - C_6)$ アルキルであり；

各 R^6 は、独立して、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ アルキニル又は $(C_1 - C_6)$ アルコキシであり；

V^1 は、 $(C_1 - C_6)$ アルキレン、 $(C_1 - C_6)$ アルケニレン、 $(C_1 - C_6)$ アルキニレン又は $(C_1 - C_6)$ アルキレンオキシであり；

各 R^7 は、独立して、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル又は $(C_3 - C_6)$ シクロアルコキシであり；

R^8 は、ヘテロシクリルであり；そして、

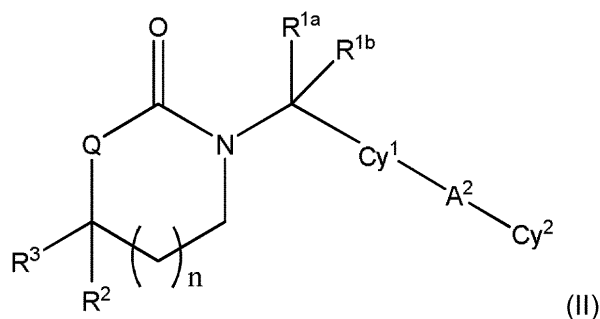
R^9 は、 $(C_4 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、 $(C_4 - C_7)$ シクロアルキルアルコキシ、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル $(C_2 - C_4)$ アルキニル、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルキル、ハロ $(C_2 - C_6)$ アルケニル、ハロ $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、ハロ $(C_4 - C_7)$ シクロアルキルアルキル、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、ハロ $(C_3 - C_6)$ シクロアルコキシ、ハロ $(C_4 - C_7)$ シクロアルキルアルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、ハロ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ $(C_1 - C_6)$ アルキル又はハロ $(C_1 - C_6)$ アルコキシ $(C_1 - C_6)$ 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 (II)：

【化 68】



[式中、

R^{1a} は、場合により置換されている $(C_3 - C_5)$ シクロアルキルであり；

R^{1b} は、水素又は場合により置換されている $(C_1 - C_6)$ アルキルであり；そして、

Cy^2 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。

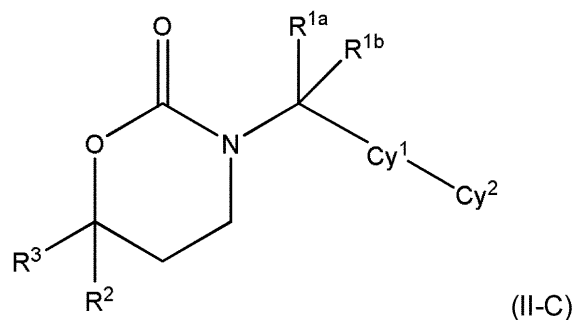
【請求項 3】

Cy^1 が、場合により置換されている、シクロヘキシル、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 (II-C)：

【化 7 1】



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、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。

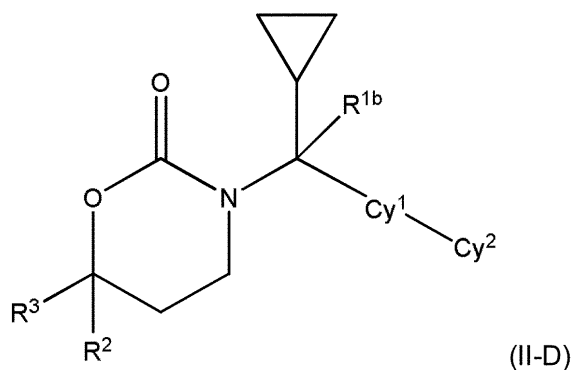
【請求項 6】

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 (II-D) :

【化 7 2】



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。

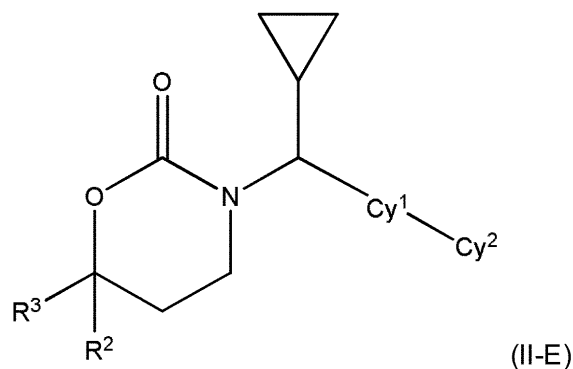
【請求項 8】

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 (II-E) :

【化 7 3】



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。

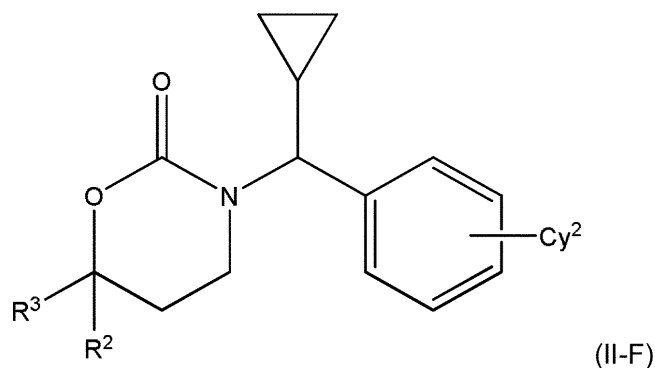
【請求項 10】

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 7 4】



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、(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(=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、FCH₂CH₂NH、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)CMe₂CH₂、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；

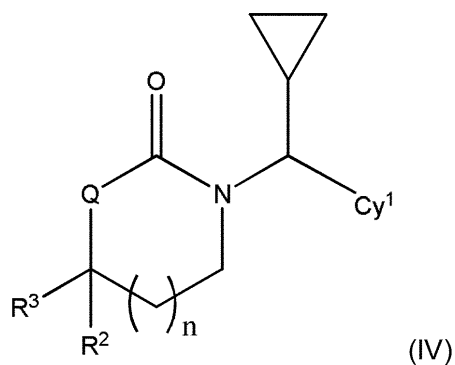
Cy¹により示される基が、ハロ、メチル、トリフルオロメチル、ヒドロキシ、メトキシ、メトキシカルボニル、カルボキシ、エトキシカルボニルメトキシ、2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロポキシ、シアノ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロエトキシ、t - ブトキシカルボニル、ヒドロキシメチル、2 - ヒドロキシエチル、2 - ヒドロキシ - 2 - プロピル、メトキシメチル、メチルスルホニル、メチルスルホニルアミノ、N - メチル - メチルスルホニルアミノ及びベンジルオキシカルボニルから独立して選択される、1 ~ 4個の基で場合により置換されており；そして、

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 7 9】



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。

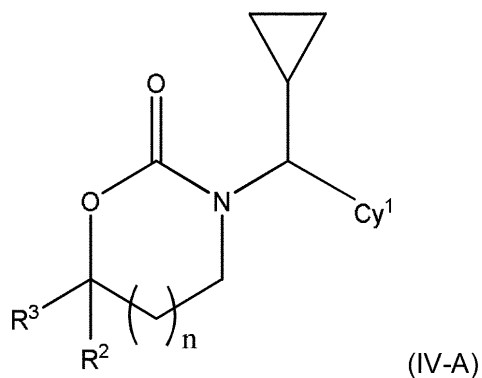
【請求項 1 6】

Cy¹ が、場合により置換されている、シクロヘキシル、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 1 5 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

構造式 (IV - A) :

【化 8 0】

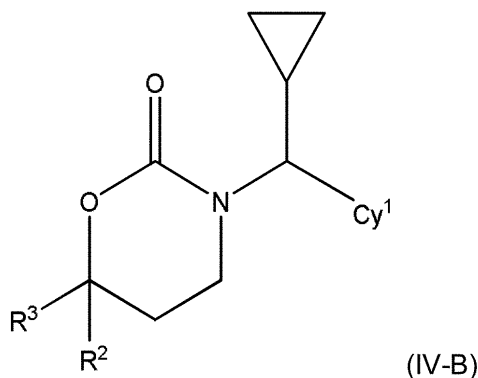


により示される請求項 1 6 に記載の化合物又はその薬学的に許容し得る塩、エナンチオマー若しくはジアステレオマー。

【請求項 1 8】

構造式 (IV - B) :

【化 8 1】



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、FCH₂CH₂NH、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、(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)₂ NH - 、 H₂ NC (= O) - 、 Me NHC (= O) - 、 HO₂ C - 、 (HO)₂ P (= O) O - 、 H₂ NS (= O)₂ O - 、 H₂ NS (= O)₂ NH - 、 Me NHC (= O) NH - 、 Me NHC (= O) O - 、 オキソ、シアノ、HO₂ C - 、 HOCH₂CH₂NH - 、 4 - モルホリノ、HOCH₂C (= O) NH - 、 H₂NCH₂C (= O) NH - 、 Et NHC (= O) NH、Me OC (= O) NH - 、 Me NHC (= NC N) NH - 、 Me S - 、 Me SO₂ - 、 - Me SO₂ N (Me) - 、 Me S (= O)₂ NHC (= 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 H₂CH₂NH、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 - 、 Me NH - 、 Me₂N - 及び Me CONMe 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】

R² が、フェニル又はフルオロフェニルであり；

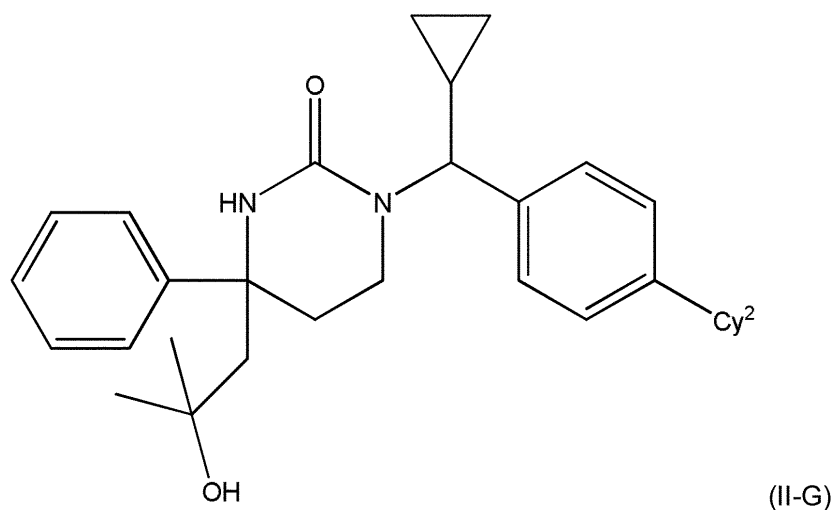
R³ が、2 - メチルアリル、2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル又は 2 - シアノ - 2 - メチルプロピルであり；そして、

Cy¹ 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、OCHF₂ 又は CF₃ 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 (II - G) :

【化 82】



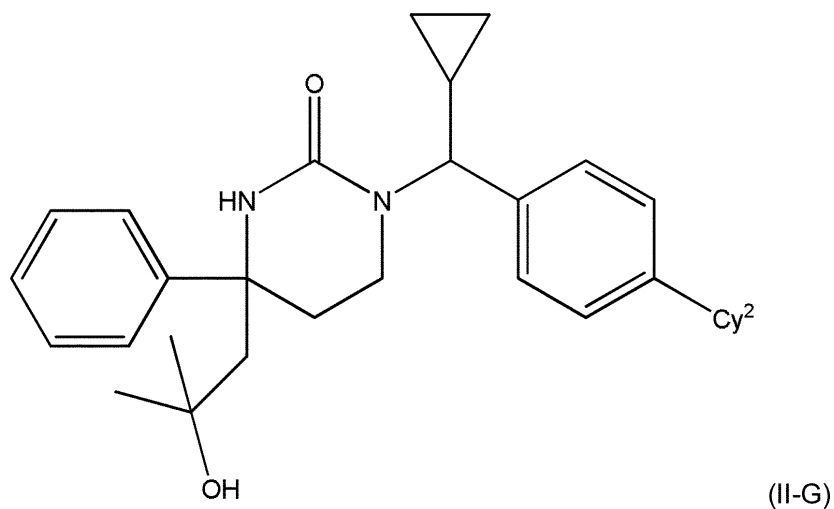
[式中、Cy² は、場合によりメチル、シクロプロピル、シアノ、CONH₂、CONHMe 又は CONMe₂ で置換されている、ピリジル、ピリダジニル又はピリミジニル基である]

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 24】

構造式 (II - G) :

【化 8 3】



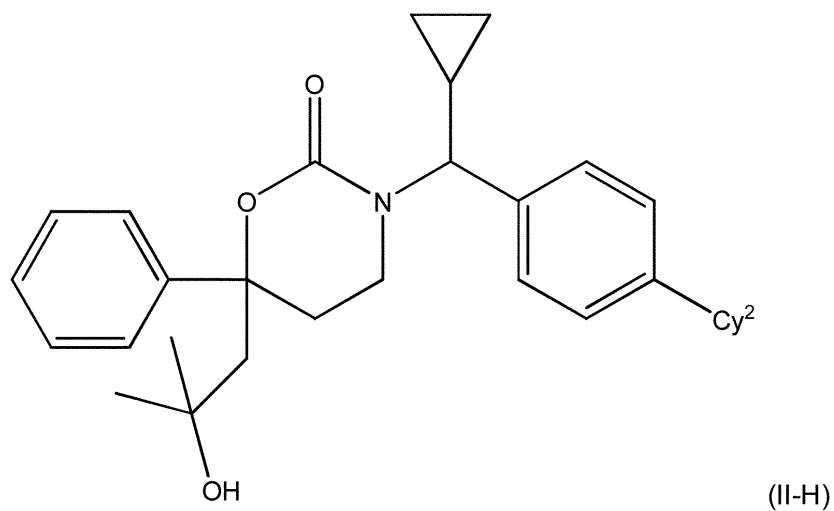
[式中、Cy²は、場合によりメチル、エチル、プロピル、イソプロピル又はシクロプロピルで環窒素が置換されているオキシジヒドロピリジル基である]

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 8 4】



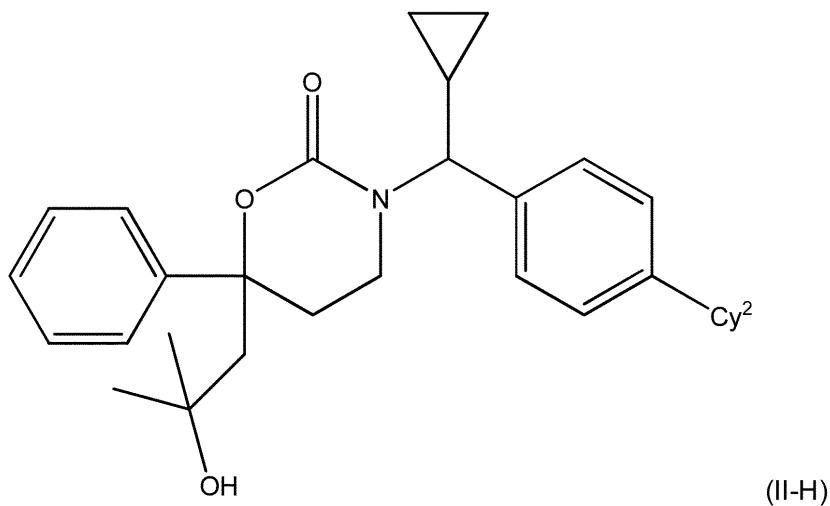
[式中、Cy²は、場合によりメチル、シクロプロピル、シアノ、CONH₂、CONHMe又はCONMe₂で置換されている、ピリジル、ピリダジニル又はピリミジニル基である]

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-H) :

【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シ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 27】

11 - HSD 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 ~ 26 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 28】

i) 薬学的に許容し得る担体又は希釈剤；及び ii) 請求項 1 ~ 26 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。