

【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20年7月3日(2008.7.3)

【公表番号】特表2007-538085(P2007-538085A)

【公表日】平成19年12月27日(2007.12.27)

【年通号数】公開・登録公報2007-050

【出願番号】特願2007-527347(P2007-527347)

【国際特許分類】

C 0 7 D	207/08	(2006.01)
C 0 7 D	207/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/402	(2006.01)
A 6 1 K	31/40	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	21/04	(2006.01)
A 6 1 P	5/26	(2006.01)
A 6 1 P	5/30	(2006.01)
A 6 1 P	5/24	(2006.01)
A 6 1 P	15/10	(2006.01)
A 6 1 P	15/08	(2006.01)
A 6 1 P	15/12	(2006.01)
A 6 1 P	3/02	(2006.01)
A 6 1 P	19/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	25/18	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	3/00	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	3/06	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
C 0 7 D	211/18	(2006.01)
A 6 1 K	31/451	(2006.01)
A 6 1 K	31/4468	(2006.01)
C 0 7 D	211/58	(2006.01)
C 0 7 D	265/30	(2006.01)
A 6 1 K	31/5375	(2006.01)
C 0 7 D	211/22	(2006.01)
C 0 7 D	451/06	(2006.01)
A 6 1 K	31/46	(2006.01)
C 0 7 D	451/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
C 0 7 D	207/20	(2006.01)
C 0 7 D	295/04	(2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)  
 C 0 7 D 491/20 (2006.01)  
 C 0 7 D 487/08 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/407 (2006.01)  
 C 0 7 D 215/38 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/47 (2006.01)  
 C 0 7 D 217/22 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/472 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 D 207/08	C S P
C 0 7 D 207/12	
A 6 1 K 31/402	
A 6 1 K 31/40	
A 6 1 P 43/00	1 0 1
A 6 1 P 21/04	
A 6 1 P 5/26	
A 6 1 P 5/30	
A 6 1 P 5/24	
A 6 1 P 15/10	
A 6 1 P 15/08	
A 6 1 P 15/12	
A 6 1 P 3/02	
A 6 1 P 19/04	
A 6 1 P 25/24	
A 6 1 P 25/22	
A 6 1 P 25/18	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 9/10	
A 6 1 P 9/00	
A 6 1 P 9/12	
A 6 1 P 9/10	1 0 3
A 6 1 P 9/10	1 0 1
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 3/00	
A 6 1 P 3/10	
A 6 1 P 3/06	
A 6 1 P 3/04	
A 6 1 P 31/18	
C 0 7 D 211/18	
A 6 1 K 31/451	
A 6 1 K 31/4468	
C 0 7 D 211/58	
C 0 7 D 265/30	
A 6 1 K 31/5375	
C 0 7 D 211/22	
C 0 7 D 451/06	
A 6 1 K 31/46	
C 0 7 D 451/04	
A 6 1 K 31/5377	
A 6 1 K 31/496	

C 0 7 D 207/20  
 C 0 7 D 295/04                      Z  
 A 6 1 K 31/55  
 C 0 7 D 491/20  
 C 0 7 D 487/08  
 A 6 1 K 31/407  
 C 0 7 D 215/38  
 A 6 1 K 31/47  
 C 0 7 D 217/22  
 A 6 1 K 31/472

## 【手続補正書】

【提出日】平成20年5月15日(2008.5.15)

## 【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

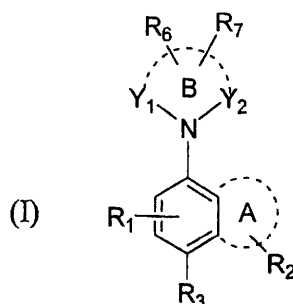
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(I)によって表される化合物、

【化 1】



(式中、

$R_1$  および  $R_2$  は、各々独立して、水素、低級アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロ、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、低級アミノアルキル、低級アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、 $COOR_4$ 、 $CONR_4R_5$ 、 $NHCO R_4$ 、 $NHSO_2 R_4$ 、 $OCOR_4$ 、 $COR_4$ 、 $SR_4$ 、 $S(O)_n R_8$ 、 $SO_2 NR_8 R_9$  からなる群から選択される；

$R_3$  は、シアノ、ニトロ、 $S(O)_n R_8$ 、 $SO_2 NR_8 R_9$ 、 $OSO_2 R_4$ 、 $P(O)(OR_4)(OR_5)$ 、 $P(O)(OH)(NR_4 R_5)$ 、 $PO(NR_4 R_5)_2$ 、 $COOR_4$  からなる群から選択される；

環 A は、 $NR_6 R_7$ 、O、 $SO_2$ 、S、 $C=O$  および  $C=S$  からなる群から選択される 2 個までのヘテロ原子を含有する、6 員の、任意で芳香族の、部分飽和もしくは完全飽和炭素環もしくは複素環である；

環 B は、任意に置換されたトロパンである；

$Y_1$  および  $Y_2$  は、 $CR_6 R_7$  である；

$R_4$  および  $R_5$  は、各々独立して、水素、シアノ、任意に置換されたアルキル、任意に置換されたアルケニル、任意に置換されたアルキニル、任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意に置換されたアリールアルキル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリールアルキル、任意に置換されたヘテロアリールからなる群から選択される；

$R_6$  および  $R_7$  は、各々独立して、水素、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、任意に置換されたアルキル、任意に置換されたアルケニル、任意に置換されたアルキニル、任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意に置換されたアリールアルキル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリールアルキル、任意に置換されたヘテロアリール、 $OR_4$ 、 $NR_4R_5$ 、 $SR_4$ 、 $COR_4$ 、 $COOR_4$ 、 $CONR_4R_5$ 、 $NHCOR_4$ 、 $OCOR_4$ 、 $CSR_4$ 、 $CSOR_4$ 、 $CSNR_4R_5$ 、 $NHCSR_4$ 、 $OCSR_4$ 、 $S(O)_nR_4$ 、 $SO_2NR_4R_5$ 、 $OSO_2R_4$ 、 $NHSO_2R_4$  からなる群から選択される；

$R_8$  および  $R_9$  は、各々独立して、水素、任意に置換されたアルキル、任意に置換されたアルケニル、任意に置換されたアルキニル、任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたヘテロシクリルアルキル、任意に置換されたアリールアルキル、任意に置換されたヘテロアリールアルキルからなる群から選択される；および

$n$  は、1～3の整数である）またはその医薬上許容される塩、アミド、もしくは立体異性体。

【請求項2】

環Aは、ベンゼン、シクロヘキシルまたはピリジンである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

$R_3$  は、シアノ、ニトロ、 $S(O)_nR_8$  または  $SO_2NR_8R_9$  である、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

$R_3$  は、シアノまたはニトロである、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

環Bは、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、任意に置換されたアルコキシ、任意に置換されたアルキル、任意に置換されたアルケニル、任意に置換されたアルキニル、任意に置換されたアミノアルキル、および  $NHCOR_4$  からなる群から選択される1つまたは複数の基で任意に置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

環Bは、1つまたは複数のヒドロキシ基と任意に置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

$R_6$  もしくは  $R_7$  は、ヒドロキシまたはアルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

4 - ( 3 - エンド - ヒドロキシ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル )  
ナフタレン - 1 - カルボニトリル、

4 - ( 3 - オキソ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、

4 - { 3 - [ 2 - ( 1 H - イミダゾール - 4 - イル ) エチルアミノ ] - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル } ナフタレン - 1 - カルボニトリル、二塩酸塩、

4 - [ 3 - ( シクロヘキシルメチルアミノ ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ] ナフタレン - 1 - カルボニトリル、塩酸塩、

4 - [ 3 - ( 2 - モルホリン - 4 - イルエチルアミノ ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ] ナフタレン - 1 - カルボニトリル、二塩酸塩、

メトキシ酢酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、

3 - モルホリン - 4 - イルプロピオン酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、塩酸塩、

3 - ( 4 - エチルピペラジン - 1 - イル ) プロピオン酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、塩酸塩、

3 - ジエチルアミノプロピオン酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) -

8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、塩酸塩、  
 クロロ酢酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、  
 モルホリン - 4 - イル酢酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、塩酸塩、  
 イミダゾール - 1 - イル酢酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、塩酸塩、  
 ( 4 - エチルピペラジン - 1 - イル ) 酢酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、二塩酸塩、  
 ジエチルアミノ酢酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、塩酸塩、  
 コハク酸モノエンド - [ 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イル ] エステル、  
 トリフルオロ酢酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、  
 4 - ( エンド - 3 - メトキシ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 N - [ 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イル ] - 2 - ( 4 - エチルピペラジン - 1 - イル ) アセトアミド、二塩酸塩、  
 4 - ( 3 - エンド - ヒドロキシ - 3 - エキソ - メチル - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 4 - ( 3 - エンド - ヒドロキシ - 3 - エキソ - プロピル - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 4 - ( エンド - スピロ [ 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタン - 3 , 2 ' - オキシラン ] - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 4 - ( 3 - エキソ - シアノメチル - 3 - エンド - ヒドロキシ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 4 - ニトロ安息香酸エキソ - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、  
 4 - ( 3 - エキソ - ヒドロキシ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 4 - ( 3 - エキソ - メトキシ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 4 - ( 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 2 - エン - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 4 - ( 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 3 - ピロリジン - 1 - イル - プロピオン酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、フマル酸塩、  
 3 - イミダゾール - 1 - イル - プロピオン酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、フマル酸塩、  
 3 - ピラゾール - 1 - イル - プロピオン酸エンド - 8 - ( 4 - シアノ - ナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、フマル酸塩、  
 4 - ( 2 - メチル - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イル二水素リン酸塩、  
 2 - エキソ - [ 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 3 - エンド - ヒドロキシ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イル ] - N , N - ジメチルエタンスルホンアミド、

4 - ( 3 - エンド - ヒドロキシ - 3 - エキソ - メチル - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、塩酸塩、

4 - ( 3 - メチル - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 2 - エン - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、

3 - ピペラジン - 1 - イルプロピオン酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、二塩酸塩、

3 - [ ビス ( 2 - ヒドロキシエチル ) アミノ ] プロピオン酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、フマル酸塩、

3 - ( 3 - ジメチルアミノピロリジン - 1 - イル ) プロピオン酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、二フマル酸塩、

3 - ( 4 - メチルピペラジン - 1 - イル ) プロピオン酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザ - ビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、二フマル酸塩、および

4 - ( 3 - ジエチルアミノメチル - 3 - ヒドロキシ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、塩酸塩、からなる群から選択される化合物。

【請求項 9】

4 - ( 3 - エンド - ヒドロキシ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、

3 - ( 4 - エチルピペラジン - 1 - イル ) プロピオン酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、塩酸塩、

3 - ジエチルアミノプロピオン酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、塩酸塩、

4 - ( 3 - エンド - ヒドロキシ - 3 - エキソ - メチル - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、

4 - ( 3 - エンド - ヒドロキシ - 3 - エキソ - プロピル - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、

4 - ( エンド - スピロ [ 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタン - 3 , 2 ' - オキシラン ] - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、

4 - ( 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 2 - エン - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、

4 - ( 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、

4 - ( 2 - メチル - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、

4 - ( 3 - エンド - ヒドロキシ - 3 - エキソ - メチル - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、塩酸塩、および

4 - ( 3 - メチル - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 2 - エン - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、からなる群から選択される化合物。

【請求項 10】

4 - ( 3 - プロピルアミノ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、塩酸塩、

4 - ( 3 - ジメチルアミノ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、塩酸塩、

4 - [ 3 - ( 3 - ヒドロキシプロピルアミノ ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ] ナフタレン - 1 - カルボニトリル、塩酸塩、

4 - [ 3 - ( 2 - エトキシエチルアミノ ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト -

8 - イル]ナフタレン - 1 - カルボニトリル、塩酸塩、  
 4 - ( 3 - シクロプロピルアミノ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル )  
 )ナフタレン - 1 - カルボニトリル、塩酸塩、  
 4 - [ 3 - ( 2 - ジメチルアミノエチルアミノ ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オ  
 クト - 8 - イル]ナフタレン - 1 - カルボニトリル、二塩酸塩、  
 4 - { 3 - [ ( フラン - 2 - イルメチル ) アミノ ] - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ]  
 オクト - 8 - イル } ナフタレン - 1 - カルボニトリル、塩酸塩、  
 4 - { 3 - [ ( ピリジン - 2 - イルメチル ) アミノ ] - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1  
 ] オクト - 8 - イル } ナフタレン - 1 - カルボニトリル、二塩酸塩、  
 4 - [ 3 - ( 2 - イソプロポキシエチルアミノ ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オ  
 クト - 8 - イル]ナフタレン - 1 - カルボニトリル、塩酸塩、  
 4 - ( 3 - ヒドロキシイミノ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナ  
 フタレン - 1 - カルボニトリル、  
 3 - クロロプロピオン酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザ  
 ビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、  
 4 - ( 3 - エキソ - エチニル - 3 - エンド - ヒドロキシ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 .  
 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 4 - [ 3 - ( 2 - [ 1 , 3 ] ジオキサン - 2 - イルエチル ) - 3 - ヒドロキシ - 8 - ア  
 ザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル]ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 4 - ( 3 - アミノ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン -  
 1 - カルボニトリル、塩酸塩、  
 2 - クロロ - N - [ 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3  
 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イル ] アセトアミド、塩酸塩、  
 N - [ 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オ  
 クト - 3 - イル ] - 2 - ジエチルアミノアセトアミド、塩酸塩、  
 2 - シアノエチルエンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシク  
 ロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イル N , N - ジイソプロピルアミドリッ酸塩、  
 エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ]  
 オクト - 3 - イル水素 N , N - ジイソプロピルアミドリッ酸塩、  
 [ 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト  
 - 3 - イル ] ウレア、  
 ジメチルカルバミン酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビ  
 シクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、  
 4 - [ 3 - エキソ - ( 4 - エチルピペラジン - 1 - イルメチル ) - 3 - エンド - ヒドロ  
 キシ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル]ナフタレン - 1 - カルボニト  
 リル、  
 4 - ( 3 - エンド - ヒドロキシ - 3 - エキソ - ヒドロキシメチル - 8 - アザビシクロ [  
 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 4 - ( 3 - エンド - ヒドロキシ - 3 - エキソ - { [ 2 - ( 1 H - イミダゾール - 4 イル  
 ) エチルアミノ ] メチル } - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタ  
 レン - 1 - カルボニトリル、  
 4 - ( 3 - エンド - ヒドロキシ - 3 - エキソ - メトキシメチル - 8 - アザビシクロ [ 3  
 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 アクリル酸エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3  
 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルエステル、  
 4 - ( 2 - メチル - 3 - オキソ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル )  
 ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 4 - ( 3 - エキソ - ベンジル - 3 - エンド - ヒドロキシ - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 .  
 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト -

2 - エン - 2 - カルボン酸メチルエステル、  
 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタン  
 - 2 - カルボン酸メチルエステル、  
 4 - ( 2 - ヒドロキシメチル - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 2 - エン - 8  
 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 ( 1 R , 2 R , 3 S , 5 S ) - 3 - ベンゾイルオキシ - 8 - ( 4 - シアノナフタレン -  
 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタン - 2 - カルボン酸メチルエステル  
 、  
 ( 1 R , 2 R , 3 S , 5 S ) - 4 - ( 3 - ヒドロキシ - 2 - ヒドロキシメチル - 8 - ア  
 ザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 8 - イル ) ナフタレン - 1 - カルボニトリル、  
 2 - シアノエチルエンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシク  
 ロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イル N , N - ジイソプロピルアミド亜リン酸塩、  
 2 - シアノエチルエンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシク  
 ロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルジイソプロピルアミドリリン酸塩、  
 2 - シアノエチルエチルエンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザ  
 ビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルリン酸塩、  
 エチルエンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2  
 . 1 ] オクト - 3 - イル水素リン酸塩、  
 ビス ( 2 - シアノエチル ) エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - ア  
 ザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルリン酸塩、  
 2 - シアノエチルエンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシク  
 ロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イルフェニルリン酸塩、  
 エンド - 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ]  
 オクト - 3 - イルフェニル水素リン酸塩、  
 N - [ 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オ  
 クト - 3 - イル ] アセトアミド、  
 3 - クロロ - N - [ 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3  
 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イル ] プロパンアミド、  
 N - [ 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オ  
 クト - 3 - イル ] - 3 - ( 4 - エチルピペラジン - 1 - イル ) プロパンアミド、二塩酸塩  
 、  
 N - [ 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オ  
 クト - 3 - イル ] - 3 - ジエチルアミノプロピオンアミド、塩酸塩、  
 N - [ 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オ  
 クト - 3 - イル ] - 3 - ( 1 H - イミダゾール - 1 - イル ) プロパンアミド、塩酸塩、  
 N - [ 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オ  
 クト - 3 - イル ] - 2 - ( エトキシエトキシ ) アセトアミド、  
 N ' - [ 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ]  
 オクト - 3 - イル ] - 4 - メチルベンゼンスルホニルヒドラゾン、  
 3 - エキソ - [ 8 - ( 4 - シアノナフタレン - 1 - イル ) - 3 - エンド - ヒドロキシ -  
 8 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクト - 3 - イル ] - N , N - ジメチルプロパンアミド  
 、からなる群から選択される化合物。

【請求項 1 1】

アンドロゲン受容体に請求項 1 から 1 0 の何れか一項に記載の化合物を接触させること  
 により前記受容体を活性化させるための、請求項 1 から 1 0 の何れか一項に記載の化合物  
 を含む医薬組成物。

【請求項 1 2】

性機能不全症の症状を緩和するための、請求項 1 から 1 0 の何れか一項に記載の化合物  
 を含む医薬組成物。

【請求項 1 3】



疾患を治療する、またはその症状を緩和するための、請求項 1 ~ 10 の何れか一項に記載の化合物を含む医薬組成物であって、

前記疾患が、正常より低い血漿テストステロンレベル、男性における不妊症、男性における勃起障害、男性における男性休止、女性における子宮内膜症、女性における性交疼痛症、女性における膣瘻、女性における性的覚醒障害、女性における性的オルガスム障害、男性における性欲障害、悪液質、H I V 衰弱、筋消耗が明白な臨界的疾患、筋肉減少症；虚弱；低い身長；矮小発育症；骨密度低下；幸福感の欠如、活気の欠如、怒り、過敏性、悲嘆、疲労、および神経質を含む気分障害；抑うつ；言語の流暢さおよび空間的記憶を含む認知機能障害；アルツハイマー病、軽度の認知症（M C I）、ルイス体認知症（L e w i s b o d y d e m e n t i a）、および前頭側頭型認知症を含む神経変性障害；眼球乾燥症；脂質代謝異常、アテローム硬化症および非インスリン依存性糖尿病（N I D D M）を含む代謝障害；高血圧、冠動脈疾患、および心筋灌流を含むがそれらに限定されない心血管障害；肥満；貧血；前立腺癌；ならびに統合失調症からなる群から選択される医薬組成物。

【請求項 14】

ホルモン補充療法のための、請求項 1 ~ 10 の何れか一項に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 15】

前記ホルモン補充療法の必要が、外科的もしくは化学的手段による精巣摘除術によって引き起こされる、請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

筋ジストロフィー、筋緊張性ジストロフィー、グルココルチコイド療法下の喘息を含む状態における筋力を改善するための、請求項 1 ~ 10 の何れか一項に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 17】

骨密度低下；眼球乾燥症；脂質代謝異常、アテローム硬化症および非インスリン依存性糖尿病（N I D D M）を含む代謝障害；高血圧、冠動脈疾患、および心筋灌流を含む心血管障害；肥満；ならびに前立腺癌からなる群から選択される状態を予防するための、請求項 1 ~ 10 の何れか一項に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 18】

生存、障害、機能的状態、健康の認識、および機会からなる群から選択される健康関連のクオリティ・オブ・ライフのパラメーターを改善するための、請求項 1 ~ 10 の何れか一項に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 19】

前立腺癌の進行を遅延させるための、請求項 1 ~ 10 の何れか一項に記載の化合物を含む医薬組成物。