

【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3月15日 (2012.3.15)

【公表番号】特表2010-519304(P2010-519304A)

【公表日】平成22年6月3日 (2010.6.3)

【年通号数】公開・登録公報2010-022

【出願番号】特願2009-550944(P2009-550944)

【国際特許分類】

C 0 7 D 233/34 (2006.01)

C 0 7 D 263/22 (2006.01)

C 0 7 D 265/10 (2006.01)

C 0 7 D 239/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/421 (2006.01)

A 6 1 K 31/535 (2006.01)

A 6 1 K 31/4164 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (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 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 5/50 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (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 15/08 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 31/06 (2006.01)

A 6 1 P 31/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 5/48 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 233/34 C S P

C 0 7 D 263/22

C 0 7 D 265/10

C 0 7 D 239/10

A 6 1 K 31/421
A 6 1 K 31/535
A 6 1 K 31/4164
A 6 1 K 31/505
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 43/00 1 0 7
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 7/02
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 3/06
A 6 1 P 5/50
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 9/10 1 0 1
A 6 1 P 3/00
A 6 1 P 19/10
A 6 1 P 27/06
A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 25/22
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 15/08
A 6 1 P 15/10
A 6 1 P 37/02
A 6 1 P 31/06
A 6 1 P 31/08
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 7/00
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 1/18
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 13/12
A 6 1 P 5/48
A 6 1 P 31/12

【手続補正書】

【提出日】平成23年2月10日(2011.2.10)

【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

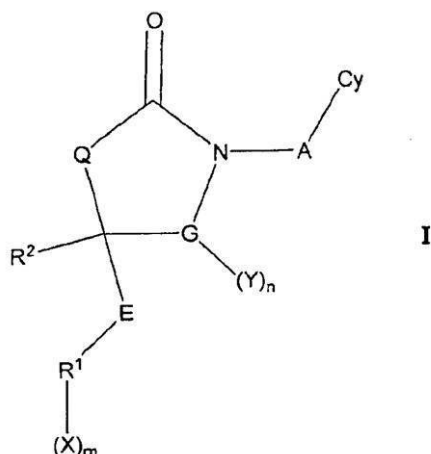
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(1)



(式中：

$Q = NR^3$ 、OまたはS；

R^1 は、

(1) H；

(2) (C_1-C_8) アルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル、ヘテロシクリル、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) アルキルチオ (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) アルキルスルフィニル (C_1-C_4) アルキル、および (C_1-C_4) アルキルスルホニル (C_1-C_4) アルキル；ならびに

(3) フェニル、フェニル (C_1-C_4) アルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアリール (C_1-C_4) アルキル

からなる群より選択される；

Xは、独立して、ハロゲン、OH、 CH_2OH 、 (C_1-C_3) アルキル、 (C_1-C_3) ハロアルキル、 OR^+ 、O (C_1-C_3) ハロアルキル、CN、 CH_2CN 、 NO_2 、 CH_2NO_2 、SH、 SR^+ 、 SO_2H 、 CH_2SO_2H 、 SO_2R^+ 、 $CH_2SO_2R^+$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^+ 、 $SO_2NR^+_2$ 、 $CH_2SO_2NH_2$ 、 $CH_2SO_2NHR^+$ 、 $CH_2SO_2NR^+_2$ 、 SO_2CF_3 、 $CH_2SO_2CF_3$ 、CONH $_2$ 、CONHR $^+$ 、CONR $^+_2$ 、 CH_2CONH_2 、 CH_2CONHR^+ 、 $CH_2CONR^+_2$ 、 CO_2H 、 CH_2CO_2H 、NH $_2$ 、NHR $^+$ 、NR $^+_2$ 、 (C_1-C_3) アルキル(NH $_2$)、 (C_1-C_3) アルキル(NHR $^+$)、 (C_1-C_3) アルキル(NR $^+_2$)、アリール、ヘテロアリール、 SO_3H 、 CH_2SO_3H および任意にオキソ、アルキル、ハロアルキルまたはヒドロキシルで置換されるヘテロシクリルからなる群より選択される；

R^1 がヘテロシクリルまたはヘテロアリールである場合、Xはまたオキソでもあり得る；

$m=0$ 、1、2または3；

R^2 および R^3 は、独立して、

(1) H；

(2) 独立して、ハロゲン、OH、 $(=O)$ 、CONH $_2$ 、 CO_2H 、COCH $_3$ 、 $C(O)_2CH_3$ 、NH $_2$ 、NHR $^+$ 、NR $^+_2$ 、アリール、ヘテロアリール、シアノ、 OR^+ 、 SR^+ 、 $S(=O)R^+$ 、 $S(=O)_2R^+$ 、OP $(=O)(OH)_2$ 、NH SO_2R^+ 、NR $^+SO_2R^+$ 、NHC $(=O)R^+$ 、NR $^+C(=O)R^+$ 、NHC $(=O)OR^+$ 、NR $^+C(=O)OR^+$ 、NHC $(=O)NH_2$ 、NHC $(=O)NHR^+$ 、NHC $(=O)N(R^+)_2$ 、NR $^+C(=O)NH_2$ 、NR $^+C(=O)NHR^+$ 、NR $^+C(=O)N(R^+)_2$ 、OC $(=O)NH_2$ 、OC $(=O)NHR^+$ 、OC $(=O)N(R^+)_2$ 、NHS $(=O)_2OR^+$ 、NR $^+S(=O)_2OR^+$ 、NHS $(=O)_2NH_2$ 、NHS $(=O)_2NHR^+$ 、NHS $(=O)_2N(R^+)_2$ 、NR $^+S(=O)_2NH_2$ 、NR $^+S(=O)_2NHR^+$ 、NR $^+S(=O)_2N(R^+)_2$ 、OS $(=O)_2NH_2$ 、OS $(=O)_2NHR^+$ 、OS $(=O)_2N(R^+)_2$ 、およびヘテロシクリルからなる群より選択される1~3個の置換基でそれぞれ任意に置換される (C_1-C_8) アルキル、 (C_3-C_7) シクロアルキル、ヘテロシクリル、 (C_1-C_4) アルコキシ (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) アルキルチオ (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) アルキルスルフィニル (C_1-C_4) アルキル、および (C_1-C_4) アルキルスルホニル (C_1-C_4) アルキル；ならびに

(3) 独立して、ハロゲン、OH、 CH_2OH 、 (C_1-C_3) アルキル、 (C_1-C_3) ハロアルキル、 OR^+ 、O (C_1-C_3) ハロアルキル、CN、 CH_2CN 、 NO_2 、 CH_2NO_2 、SH、 SR^+ 、 SO_3H 、 CH_2SO_3H 、 SO_2R^+ 、 $CH_2SO_2R^+$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^+ 、 $SO_2NR^+_2$ 、 $CH_2SO_2NH_2$ 、 $CH_2SO_2NHR^+$ 、 $CH_2SO_2NR^+_2$ 、 SO_2CF_3 、 $CH_2SO_2CF_3$ 、CONH $_2$ 、CONHR $^+$ 、CONR $^+_2$ 、 CH_2CONH_2 、 CH_2CONHR^+ 、 $CH_2CONR^+_2$ 、 CO_2H 、 CH_2CO_2H 、NH $_2$ 、NHR $^+$ 、NR $^+_2$ 、 (C_1-C_3) アルキル(NH $_2$)、 (C_1-C_3) アルキル(NHR $^+$)、 (C_1-C_3) アルキル(NR $^+_2$)

アリール、ヘテロアリール、 SO_2H 、および $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{H}$ からなる群より選択される1~3個の置換基でそれぞれ任意に置換されるフェニル、フェニル($\text{C}_1\text{-C}_4$)アルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリール($\text{C}_1\text{-C}_4$)アルキル

からなる群より選択される；

各 R^1 は独立して $\text{C}_1\text{-C}_3$ アルキルである；

ただし

1) Eが結合である場合、 R^1 および R^2 は両方水素とはならない；および

2) mが0より大きい場合 R^1 は水素ではない；

ただしOおよびSが R^1 に結合している場合、Eは、結合、 CH_2 、 CHMe 、 CMe_2 、 CH_2CH_2 、 OCH_2 、 OCHMe 、 OCMe_2 、 SCH_2 、 SCHMe 、または SCMe_2 である；

Gは、1、2または3個の炭素のアルキレン鎖である；

Yは、独立して、ハロゲン、($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキル、 CF_3 、 CONH_2 、 CH_2CONH_2 、 CO_2H 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキルアミノ($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキルおよびジ($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキルアミノ($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキルからなる群より選択される；

$n=0$ 、1、2または3；

A=結合、 CH_2 、 CHMe 、 CMe_2 、または CH_2CH_2 ；

Cy=1~2個の炭素原子が独立してNおよびOから選択されるヘテロ原子で任意に置き換えられかつ独立して、ハロゲン、シアノ、($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキル、ハロ($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシ($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキル、アミノ、($\text{C}_1\text{-C}_4$)アシルアミノ、($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキルスルホニルアミノ、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキルカルバモイル、ジ($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキルカルバモイル、($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキルアミノスルホニル、ジ($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキルアミノスルホニル、アラキル、アリール、ヘテロアリール、オキソ置換ヘテロアリール、アミノ置換ヘテロアリール、ヘテロシクリル、オキソ置換ヘテロシクリルならびに $\text{C}(=\text{NOH})\text{NH}_2$ 、 $\text{CON}(\text{R}^4)_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CON}(\text{R}^4)_2$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^4)_2$ 、 CO_2R^4 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^4$ 、 SO_2R^4 、 NR^4COR^4 、 $\text{NR}^4\text{CO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{NR}^4\text{SO}_2\text{R}^4$ および $\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^4)_2$ から選択される1~3個の基で任意に置換される($\text{C}_7\text{-C}_{12}$)ビシクロアルキルまたは($\text{C}_9\text{-C}_{12}$)トリシクロアルキルである、

ここで各 R^4 は、独立して、水素、($\text{C}_1\text{-C}_{10}$)アルキル、アリールまたはアラキルである)の化合物またはそのエナンチオマー、そのジアステレオマー、その幾何異性体またはそれらの薬学的に許容され得る塩。

【請求項2】

$\text{Q}=\text{NR}^3$ 、OまたはS；

R^1 は、

(1) H ；

(2) ($\text{C}_1\text{-C}_8$)アルキル、($\text{C}_3\text{-C}_7$)シクロアルキル、ヘテロシクリル、($\text{C}_1\text{-C}_4$)アルコキシ($\text{C}_1\text{-C}_4$)アルキル、($\text{C}_1\text{-C}_4$)アルキルチオ($\text{C}_1\text{-C}_4$)アルキル、($\text{C}_1\text{-C}_4$)アルキルスルフィニル($\text{C}_1\text{-C}_4$)アルキル、および($\text{C}_1\text{-C}_4$)アルキルスルホニル($\text{C}_1\text{-C}_4$)アルキル；ならびに

(3) フェニル、フェニル($\text{C}_1\text{-C}_4$)アルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアリール($\text{C}_1\text{-C}_4$)アルキル

からなる群より選択される；

Xは、独立して、ハロゲン、 OH 、 CH_2OH 、($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキル、($\text{C}_1\text{-C}_3$)ハロアルキル、 OR^* 、O(($\text{C}_1\text{-C}_3$)ハロアルキル)、 CN 、 CH_2CN 、 NO_2 、 CH_2NO_2 、 SH 、 SR^* 、 SO_2H 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{H}$ 、 SO_2R^* 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{R}^*$ 、 SO_2NH_2 、 SO_2NHR^* 、 SO_2NR^*_2 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NHR}^*$ 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NR}^*_2$ 、 SO_2CF_3 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 CONH_2 、 CONHR^* 、 CONR^*_2 、 CH_2CONH_2 、 $\text{CH}_2\text{CONHR}^*$ 、 $\text{CH}_2\text{CONR}^*_2$ 、 CO_2H 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 NH_2 、 NHR^* 、 NR^*_2 、($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキル(NH_2)、($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキル(NHR^*)、($\text{C}_1\text{-C}_3$)アルキル(NR^*_2)、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択される；

$m=0$ 、1、2または3；

R^2 および R^3 は、独立して、

(1) H ；

(2) 独立して、ハロゲン、 OH 、($=\text{O}$)、 CONH_2 、 CO_2H 、 COCH_3 、 $\text{C}(\text{O})_2\text{CH}_3$ 、 NH_2 、 NHR^* 、 NR^*_2 、アリールおよびヘテロアリールからなる群より選択される1~3個の置換基でそれぞれ任

意に置換される(C₁-C₈)アルキル、(C₃-C₇)シクロアルキル、ヘテロシクリル、(C₁-C₄)アルコキシ(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルチオ(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル(C₁-C₄)アルキル、および(C₁-C₄)アルキルスルホニル(C₁-C₄)アルキル；ならびに

(3) 独立して、ハロゲン、OH、CH₂OH、(C₁-C₃)アルキル、(C₁-C₃)ハロアルキル、OR⁺、O(C₁-C₃)ハロアルキル)、CN、CH₂CN、NO₂、CH₂NO₂、SH、SR⁺、SO₂H、CH₂SO₂H、SO₂R⁺、CH₂SO₂R⁺、SO₂NH₂、SO₂NHR⁺、SO₂NR⁺₂、CH₂SO₂NH₂、CH₂SO₂NHR⁺、CH₂SO₂NR⁺₂、SO₂CF₃、CH₂SO₂CF₃、CONH₂、CONHR⁺、CONR⁺₂、CH₂CONH₂、CH₂CONHR⁺、CH₂CONR⁺₂、CO₂H、CH₂CO₂H、NH₂、NHR⁺、NR⁺₂、(C₁-C₃)アルキル(NH₂)、(C₁-C₃)アルキル(NHR⁺)、(C₁-C₃)アルキル(NR⁺₂)アリアルおよびヘテロアリアルからなる群より選択される1~3個の置換基でそれぞれ任意に置換されるフェニル、フェニル(C₁-C₄)アルキル、ヘテロアリアルおよびヘテロアリアル(C₁-C₄)アルキル

からなる群より選択される；

各R⁺は独立してC₁-C₃アルキルである；

ただし

1) Eが結合である場合、R¹およびR²は両方水素とはならない；および

2) mが0より大きい場合R¹は水素ではない；

ただし OおよびSがR¹に結合している場合、Eは、結合、CH₂、CHMe、CMe₂、CH₂CH₂、OCH₂、OCHMe、OCMe₂、SCH₂、SCHMe、またはSCMe₂である；

G=1、2または3個の炭素のアルキレン鎖；

Yは、独立して、ハロゲン、(C₁-C₃)アルキル、CF₃、CONH₂、CH₂CONH₂、CO₂H、CH₂CO₂H、(C₁-C₃)アルキルアミノ(C₁-C₃)アルキルおよびジ(C₁-C₃)アルキルアミノ(C₁-C₃)アルキルからなる群より選択される；

n=0、1、2または3；

A=結合、CH₂、CHMe、CMe₂、またはCH₂CH₂；

Cy=1~2個の炭素原子が独立してNおよびOから選択されるヘテロ原子で任意に置き換えられ、かつ独立して、ハロゲン、シアノ、(C₁-C₃)アルキル、ハロ(C₁-C₃)アルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシ(C₁-C₃)アルキル、アミノ、(C₁-C₄)アシルアミノ、(C₁-C₃)アルキルスルホニルアミノ、CH₂CH₂CO₂H、(C₁-C₃)アルキルカルバモイル、ジ(C₁-C₃)アルキルカルバモイル、(C₁-C₃)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁-C₃)アルキルアミノスルホニル、アラルキル、アリアル、ヘテロアリアル、オキソ置換ヘテロアリアル、アミノ置換ヘテロアリアル、ヘテロシクリル、オキソ置換ヘテロシクリルならびにC(=NOH)NH₂、CON(R⁴)₂、CH₂CON(R⁴)₂、SO₂N(R⁴)₂、CO₂R⁴、CH₂CO₂R⁴、SO₂R⁴、NR⁴COR⁴、NR⁴CO₂R⁴およびNR⁴SO₂R⁴から選択される1~3個の基で任意に置換される(C₇-C₁₂)ビシクロアルキルまたは(C₉-C₁₂)トリシクロアルキルである；

ここで各R⁴は、独立して、水素、(C₁-C₁₀)アルキル、アリアルまたはアラルキルである、請求項1記載の化合物またはそのエナンチオマー、そのジアステレオマー、その幾何異性体またはそれらの薬学的に許容され得る塩。

【請求項3】

Qが、0またはNR³である、請求項1または2記載の化合物。

【請求項4】

Qが、NHまたはNMeであり、R¹が、(C₁-C₆)アルキル、(C₃-C₇)シクロアルキルまたはフェニルであり、R²が、Meであり、G(Y)_nが、CH₂またはCH₂CH₂であり、Cyが、1-アダマンチル、2-アダマンチル、1-ヒドロキシ-4-アダマンチル、1-ヒドロキシメチル-4-アダマンチルまたは1-カルバモイル-4-アダマンチルである、請求項3記載の化合物。

【請求項5】

Qが、0であり、R¹が、(C₁-C₆)アルキル、(C₃-C₇)シクロアルキルまたはフェニルであり、R²が、Meであり、G(Y)_nが、CH₂またはCH₂CH₂であり、Cyが、1-アダマンチル、2-アダマンチル、1-ヒドロキシ-4-アダマンチル、1-ヒドロキシメチル-4-アダマンチルまたは1-カルバモイル-4-アダマンチルである、請求項3記載の化合物。

【請求項 6】

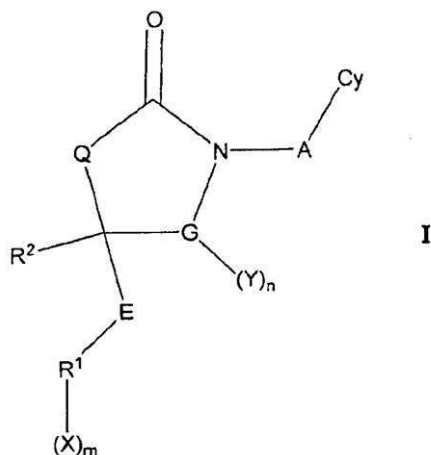
n が0であり、Eが結合である、請求項1または2記載の化合物。

【請求項 7】

R^1 がtert-ブチルである、請求項6記載の化合物。

【請求項 8】

式 I



(式中：

Qは、 NR^3 またはOである；

R^3 は、H、または $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ アルキルである；

Eは、結合、 CH_2 、 CHMe 、 CMe_2 、または CH_2CH_2 である；

R^1 は、H、 $(\text{C}_1\text{-C}_8)$ アルキル、 $(\text{C}_3\text{-C}_7)$ シクロアルキル、フェニル、フェニル $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ アルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアリール $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ アルキルである；

Xは、F、Cl、Br、CN、OH、 $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ アルキル、ハロ $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ アルキル、 $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ アルコキシ、 $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ アルキルスルホニル、または CONH_2 である；

m は、0、1、2または3である；

R^2 は、H、Me、または CH_2OH である；

ただし

1) Eが結合である場合、 R^1 および R^2 は両方水素とはならない；および

2) m が0より大きい場合 R^1 は水素ではない；

$G(Y)_n$ は、 CH_2 、 $\text{CH}(\text{C}_1\text{-C}_3)$ アルキル、 $\text{C}((\text{C}_1\text{-C}_3)\text{アルキル})_2$ 、または CH_2CH_2 である；

n は、0、1または2である；

Aは、結合または CH_2 である；

Cyは、1~2個の炭素原子が独立してNおよびOから選択されるヘテロ原子で任意に置き換えられ、かつ独立して、ハロゲン、シアノ、 $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ アルキル、ハロ $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ アルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシ $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ アルキル、アミノ、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ アシルアミノ、 $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ アルキルスルホニルアミノ、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ アルキルカルバモイル、ジ $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ アルキルカルバモイル、 $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ アルキルアミノスルホニル、ジ $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ アルキルアミノスルホニル、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、オキソ置換ヘテロアリール、アミノ置換ヘテロアリール、ヘテロシクリル、オキソ置換ヘテロシクリルならびに $\text{C}(=\text{N})\text{OH}$ 、 NH_2 、 $\text{CON}(\text{R}^4)_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CON}(\text{R}^4)_2$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^4)_2$ 、 CO_2R^4 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^4$ 、 SO_2R^4 、 NR^4COR^4 、 $\text{NR}^4\text{CO}_2\text{R}^4$ および $\text{NR}^4\text{SO}_2\text{R}^4$ から選択される1~3個の基で任意に置換される $(\text{C}_7\text{-C}_{12})$ ビシクロアルキルまたは $(\text{C}_9\text{-C}_{12})$ トリシクロアルキルである；

ここで R^4 は、水素、 $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ アルキル、アリールまたはアラルキルである)

の化合物またはそのエナンチオマー、そのジアステレオマー、その幾何学異性体またはそれらの薬学的に許容され得る塩。

【請求項 9】

Cyが、1-アダマンチル、2-アダマンチル、1-ヒドロキシ-3-アダマンチル、1-(ヒドロキ

【請求項 10】

【請求項 1 1】

【請求項 1 2】

【請求項 13】

【請求項 14】

【請求項 15】

(S)-3-((1-アダマンチル)メチル)-5-フェニルオキサゾリジン-2-オン;
(S)-3-((1-アダマンチル)メチル)-5-イソブチルオキサゾリジン-2-オン;
(S)-3-(1-アダマンチル)-5-イソブチルオキサゾリジン-2-オン;
(S)-3-(2-アダマンチル)-5-イソブチルオキサゾリジン-2-オン;
(S)-3-((1-アダマンチル)メチル)-5-(2-クロロフェニル)オキサゾリジン-2-オン;
(S)-3-((1-アダマンチル)メチル)-5-(t-ブチル)オキサゾリジン-2-オン;
(S)-3-(2-アダマンチル)-5-tert-ブチルオキサゾリジン-2-オン;
(S)-3-(2-アダマンチル)-5-メチル-5-フェニルオキサゾリジン-2-オン;
(S)-3-((1-アダマンチル)メチル)-5-シクロヘキシルオキサゾリジン-2-オン;
(S)-3-(2-アダマンチル)-5-シクロヘキシルオキサゾリジン-2-オン;
(R)-3-(2-アダマンチル)-5-シクロヘキシルオキサゾリジン-2-オン;
(4R,5S)-3-((1-アダマンチル)メチル)-4-メチル-5-フェニルオキサゾリジン-2-オン;
(S)-1-(2-アダマンチル)-4-tert-ブチルイミダゾリジン-2-オン;
(S)-1-(2-アダマンチル)-3-メチル-4-tert-ブチル-イミダゾリジン-2-オン;
5-(4-プロモフェニル)-3-(2-アダマンチル)オキサゾリジン-2-オン;
(S)-1-(1-アダマンチル)-4-フェニルイミダゾリジン-2-オン;
4-tert-ブチル-1-(2-アダマンチル)テトラヒドロピリミジン-2(1H)-オン;
(S)-4-シクロヘキシル-1-(2-アダマンチル)イミダゾリジン-2-オン;
(S)-4-イソプロピル-1-(2-アダマンチル)イミダゾリジン-2-オン;
5-(3-プロモフェニル)-3-(2-アダマンチル)オキサゾリジン-2-オン;
1-(2-アダマンチル)-4-(ヒドロキシメチル)-4-イソブチルイミダゾリジン-2-オン;
5-(ピフェニル-3-イル)-3-(2-アダマンチル)オキサゾリジン-2-オン; および

5-(ピフェニル-4-イル)-3-(2-アダマンチル)オキサゾリジン-2-オン

からなる群より選択される化合物、またはそのエナンチオマー、そのジアステレオマーまたはそれらの薬学的に許容され得る塩。

【請求項 16】

薬学的に許容され得る担体中に、請求項1～15いずれか記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の有効量を含む医薬組成物。

【請求項 17】

11 -HSD1の活性または発現に関連する疾患を有する哺乳動物における該疾患の治療用の医薬組成物であって、該医薬組成物は、請求項1～15いずれか記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の有効量を含む、医薬組成物。

【請求項 18】

11 -HSD1の調節を必要とする哺乳動物における11 -HSD1の調節用の医薬組成物であって、該医薬組成物は、請求項1～15いずれか記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の有効量を含む、医薬組成物。