

【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 07D 233/34 (2006.01)  
C 07D 263/22 (2006.01)  
C 07D 265/10 (2006.01)  
C 07D 239/10 (2006.01)  
A 61K 31/421 (2006.01)  
A 61K 31/535 (2006.01)  
A 61K 31/4164 (2006.01)  
A 61K 31/505 (2006.01)  
A 61P 43/00 (2006.01)  
A 61P 3/10 (2006.01)  
A 61P 3/04 (2006.01)  
A 61P 7/02 (2006.01)  
A 61P 29/00 (2006.01)  
A 61P 9/12 (2006.01)  
A 61P 3/06 (2006.01)  
A 61P 5/50 (2006.01)  
A 61P 9/00 (2006.01)  
A 61P 9/10 (2006.01)  
A 61P 3/00 (2006.01)  
A 61P 19/10 (2006.01)  
A 61P 27/06 (2006.01)  
A 61P 25/24 (2006.01)  
A 61P 25/22 (2006.01)  
A 61P 25/28 (2006.01)  
A 61P 15/08 (2006.01)  
A 61P 15/10 (2006.01)  
A 61P 37/02 (2006.01)  
A 61P 31/06 (2006.01)  
A 61P 31/08 (2006.01)  
A 61P 17/06 (2006.01)  
A 61P 7/00 (2006.01)  
A 61P 1/18 (2006.01)  
A 61P 25/00 (2006.01)  
A 61P 13/12 (2006.01)  
A 61P 5/48 (2006.01)  
A 61P 31/12 (2006.01)

【F I】

C 07D 233/34 C S P  
C 07D 263/22  
C 07D 265/10  
C 07D 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

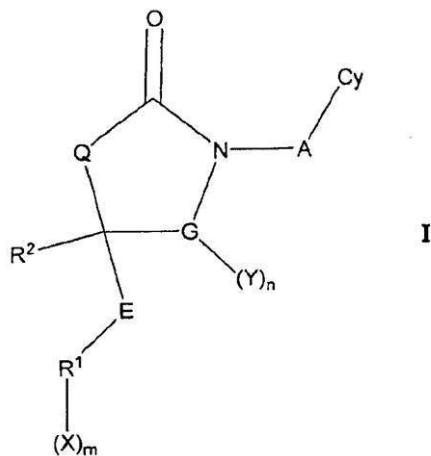
【補正方法】変更

【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、 $OR^*$ 、 $SR^*$ 、 $S(=O)R^*$ 、 $S(=O)_2R^*$ 、 $OP(=O)(OH)_2$ 、 $NH$ 、 $SO_2R^*$ 、 $NR^*SO_2R^*$ 、 $NHC(=O)R^*$ 、 $NR^*C(=O)R^*$ 、 $NHC(=O)OR^*$ 、 $NR^*C(=O)OR^*$ 、 $NHC(=O)NH_2$ 、 $NHC(=O)NHR^*$ 、 $NHC(=O)N(R^*)_2$ 、 $NR^*C(=O)NH_2$ 、 $NR^*C(=O)NHR^*$ 、 $NR^*C(=O)N(R^*)_2$ 、 $OC(=O)NH_2$ 、 $O$ 、 $C(=O)NHR^*$ 、 $OC(=O)N(R^*)_2$ 、 $NHS(=O)_2OR^*$ 、 $NR^*S(=O)_2OR^*$ 、 $NHS(=O)_2NH_2$ 、 $NHS(=O)_2NHR^*$ 、 $N$ 、 $HS(=O)_2N(R^*)_2$ 、 $NR^*S(=O)_2NH_2$ 、 $NR^*S(=O)_2NHR^*$ 、 $NR^*S(=O)_2N(R^*)_2$ 、 $OS(=O)_2NH_2$ 、 $OS(=O)_2NHR^*$ 、 $OS(=O)_2N(R^*)_2$ 、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、 $\text{SO}_2\text{H}$ 、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( $C_1\text{-}C_4$ )アルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアリール( $C_1\text{-}C_4$ )アルキル

からなる群より選択される；

各 $R^*$ は独立して $C_1\text{-}C_3$ 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0およびSが $R^1$ に結合している場合、Eは、結合、 $\text{CH}_2$ 、 $\text{CHMe}$ 、 $\text{CMe}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{OCH}_2$ 、 $\text{OCHMe}$ 、 $\text{OCMe}_2$ 、 $\text{SCH}_2$ 、 $\text{SCHMe}$ 、または $\text{SCMe}_2$ 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、( $C_1\text{-}C_3$ )アルキル、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CONH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CONH}_2$ 、 $\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、( $C_1\text{-}C_3$ )アルキルアミノ( $C_1\text{-}C_3$ )アルキルおよびジ( $C_1\text{-}C_3$ )アルキルアミノ( $C_1\text{-}C_3$ )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、 $\text{CH}_2$ 、 $\text{CHMe}$ 、 $\text{CMe}_2$ 、または $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ；

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、( $C_1\text{-}C_3$ )アルキル、ハロ( $C_1\text{-}C_3$ )アルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシ( $C_1\text{-}C_3$ )アルキル、アミノ、( $C_1\text{-}C_4$ )アシルアミノ、( $C_1\text{-}C_3$ )アルキルスルホニルアミノ、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、( $C_1\text{-}C_3$ )アルキルカルバモイル、ジ( $C_1\text{-}C_3$ )アルキルカルバモイル、( $C_1\text{-}C_3$ )アルキルアミノスルホニル、ジ( $C_1\text{-}C_3$ )アルキルアミノスルホニル、アラルキル、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 $\text{C}(=\text{NOH})\text{NH}_2$ 、 $\text{CON}(\text{R}^4)_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CON}(\text{R}^4)_2$ 、 $\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^4)_2$ 、 $\text{CO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{SO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{NR}^4\text{COR}^4$ 、 $\text{NR}^4\text{CO}_2\text{R}^4$ 、 $\text{NR}^4\text{SO}_2\text{R}^4$ 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( $C_7\text{-}C_{12}$ )ビシクロアルキルまたは( $C_9\text{-}C_{12}$ )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、( $C_1\text{-}C_{10}$ )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】

$Q=\text{NR}^3$ 、OまたはS；

$R^1$ は1；

(1) H；

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

(3) フェニル、フェニル( $C_1\text{-}C_4$ )アルキル、ヘテロアリール、およびヘテロアリール( $C_1\text{-}C_4$ )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、 $\text{OH}$ 、 $\text{CH}_2\text{OH}$ 、( $C_1\text{-}C_3$ )アルキル、( $C_1\text{-}C_3$ )ハロアルキル、 $\text{OR}^*$ 、O(( $C_1\text{-}C_3$ )ハロアルキル)、 $\text{CN}$ 、 $\text{CH}_2\text{CN}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{NO}_2$ 、 $\text{SH}$ 、 $\text{SR}^*$ 、 $\text{SO}_2\text{H}$ 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{H}$ 、 $\text{SO}_2\text{R}^*$ 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{R}^*$ 、 $\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $\text{SO}_2\text{NHR}^*$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}^*_2$ 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NHR}^*$ 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NR}^*_2$ 、 $\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{CONH}_2$ 、 $\text{CONHR}^*$ 、 $\text{CONR}^*_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CONH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CONHR}^*$ 、 $\text{CH}_2\text{CONR}^*_2$ 、 $\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{NHR}^*$ 、 $\text{NR}^*_2$ 、( $C_1\text{-}C_3$ )アルキル( $\text{NH}_2$ )、( $C_1\text{-}C_3$ )アルキル( $\text{NHR}^*$ )、( $C_1\text{-}C_3$ )アルキル( $\text{NR}^*_2$ )、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、 $\text{OH}$ 、( $=\text{O}$ )、 $\text{CONH}_2$ 、 $\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{COCH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})_2\text{CH}_3$ 、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{NHR}^*$ 、 $\text{NR}^*_2$ 、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( $C_1$ - $C_8$ )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、 $SR^*$ 、 $SO_2H$ 、 $CH_2SO_2H$ 、 $SO_2R^*$ 、 $CH_2SO_2R^*$ 、 $SO_2NH_2$ 、 $SO_2NHR^*$ 、 $SO_2NR^*_2$ 、 $CH_2SO_2NH_2$ 、 $CH_2SO_2NHR^*$ 、 $CH_2SO_2NR^*_2$ 、 $SO_2CF_3$ 、 $CH_2S$   
 $O_2CF_3$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^*$ 、 $CONR^*_2$ 、 $CH_2CONH_2$ 、 $CH_2CONHR^*$ 、 $CH_2CONR^*_2$ 、 $CO_2H$ 、 $CH_2CO_2H$ 、 $NH_2$ 、 $NHR^*$ 、 $NR^*_2$ 、( $C_1$ - $C_3$ )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；

各 $R^*$ は独立して $C_1$ - $C_3$ 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0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=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、( $C_1$ - $C_3$ )アルキル、 $CF_3$ 、 $CONH_2$ 、 $CH_2CONH_2$ 、 $CO_2H$ 、 $CH_2CO_2H$ 、( $C_1$ - $C_3$ )アルキルアミノ( $C_1$ - $C_3$ )アルキルおよびジ( $C_1$ - $C_3$ )アルキルアミノ( $C_1$ - $C_3$ )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 $CH_2CH_2$ ；

$Cy=1 \sim 2$ 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、( $C_1$ - $C_3$ )アルキル、ハロ( $C_1$ - $C_3$ )アルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシ( $C_1$ - $C_3$ )アルキル、アミノ、( $C_1$ - $C_4$ )アシルアミノ、( $C_1$ - $C_3$ )アルキルスルホニルアミノ、 $CH_2CH_2CO_2H$ 、( $C_1$ - $C_3$ )アルキルカルバモイル、ジ( $C_1$ - $C_3$ )アルキルカルバモイル、( $C_1$ - $C_3$ )アルキルアミノスルホニル、ジ( $C_1$ - $C_3$ )アルキルアミノスルホニル、アラルキル、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 $C(=NOH)NH_2$ 、 $CON(R^4)_2$ 、 $CH_2C$   
 $ON(R^4)_2$ 、 $SO_2N(R^4)_2$ 、 $CO_2R^4$ 、 $CH_2CO_2R^4$ 、 $SO_2R^4$ 、 $NR^4COR^4$ 、 $NR^4CO_2R^4$ および $NR^4SO_2R^4$ から選択される1~3個の基で任意に置換される( $C_7$ - $C_{12}$ )ビシクロアルキルまたは( $C_9$ - $C_{12}$ )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、( $C_1$ - $C_{10}$ )アルキル、アリー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、Oまたは $NR^3$ 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、 $R^1$ が、( $C_1$ - $C_6$ )アルキル、( $C_3$ - $C_7$ )シクロアルキルまたはフェニルであり、 $R^2$ が、Meであり、G(Y)<sub>n</sub>が、 $CH_2$ または $CH_2CH_2$ 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、Oであり、 $R^1$ が、( $C_1$ - $C_6$ )アルキル、( $C_3$ - $C_7$ )シクロアルキルまたはフェニルであり、 $R^2$ が、Meであり、G(Y)<sub>n</sub>が、 $CH_2$ または $CH_2CH_2$ 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】

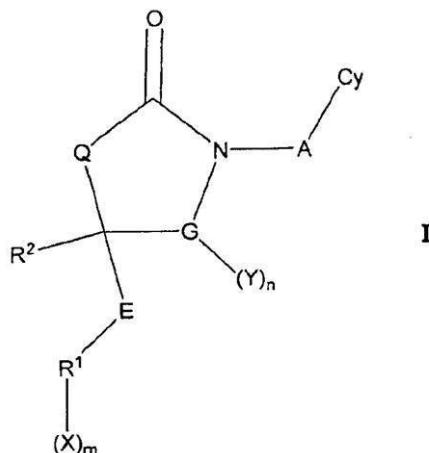
nが0であり、Eが結合である、請求項1または2記載の化合物。

## 【請求項7】

R<sup>1</sup>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<sup>3</sup>または0である；

R<sup>3</sup>は、H、または(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)アルキルである；

Eは、結合、CH<sub>2</sub>、CHMe、CMe<sub>2</sub>、またはCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>である；

R<sup>1</sup>は、H、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)シクロアルキル、フェニル、フェニル(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアリール(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルである；

Xは、F、Cl、Br、CN、OH、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキルスルホニル、またはCONH<sub>2</sub>である；

mは、0、1、2または3である；

R<sup>2</sup>は、H、Me、またはCH<sub>2</sub>OHである；

ただし

1) Eが結合である場合、R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>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<sup>1</sup>は水素ではない；

G(Y)<sub>n</sub>は、CH<sub>2</sub>、CH(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル、C((C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル)<sub>2</sub>、またはCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>である；

nは、0、1または2である；

Aは、結合またはCH<sub>2</sub>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、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル、ハロ(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル、アミノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アシルアミノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキルスルホニアミノ、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキルカルバモイル、ジ(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキルカルバモイル、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキルアミノスルホニル、ジ(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)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C(=N OH)NH<sub>2</sub>、CON(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CON(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>N(R<sup>4</sup>)<sub>2</sub>、CO<sub>2</sub>R<sup>4</sup>、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>R<sup>4</sup>、SO<sub>2</sub>R<sup>4</sup>、NR<sup>4</sup>COR<sup>4</sup>、NR<sup>4</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>4</sup>およびNR<sup>4</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>4</sup>から選択される1~3個の基で任意に置換される(C<sub>7</sub>-C<sub>12</sub>)ビシクロアルキルまたは(C<sub>9</sub>-C<sub>12</sub>)トリシクロアルキルである；

ここでR<sup>4</sup>は、水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)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

シメチル)-3-アダマンチル、1-カルバモイル-3-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、1-カルバモイル-4-アダマンチル、1-ビシクロ[2.2.2]オクチル、1-カルバモイル-4-ビシクロ[2.2.2]オクチル、9-ビシクロ[3.3.1]ノニルまたは3-カルバモイル-9-ビシクロ[3.3.1]ノニルである、請求項8記載の化合物。

**【請求項 1 0】**

$R^3$ が、HまたはMeであり、Eが、結合またはメチレンであり、 $R^1$ が、H、( $C_1-C_8$ )アルキルまたは( $C_3-C_7$ )シクロアルキルであり、Xが、Cl、BrまたはOHであり、mが、0または1であり、 $R^2$ が、H、MeまたはCH<sub>2</sub>OHであり、G(Y)<sub>n</sub>が、CH<sub>2</sub>、CHCH<sub>3</sub>またはCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>であり、Aが、結合またはメチレンであり、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8記載の化合物。

**【請求項 1 1】**

Eが、結合であり、 $R^1$ が、フェニルであり、Xが、フッ素であり、mが、0、1または2である、請求項1、2または8記載の化合物。

**【請求項 1 2】**

Eが、結合であり、 $R^1$ が、フェニルであり、Xが、モノフルオロフェニルまたはジフルオロフェニルであり、mが、1である、請求項1または2記載の化合物。

**【請求項 1 3】**

Eが、結合であり、 $R^1$ が、フェニルであり、Xが、アルキル、アルコキシ、チオアルコキシ、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<sub>2</sub>H、CONH<sub>2</sub>、N-モノアルキル置換アミドもしくはN,N-ジアルキル置換アミドで任意に置換されたピリジルまたはオキソによって任意に置換されたピリジルであるか、あるいはXが、アルキル、ハロアルキルまたはヒドロキシで任意にさらに置換されたオキソ置換ヘテロシクリルであり、mが、1である、請求項1または2記載の化合物。

**【請求項 1 4】**

$R_2$ が、ヒドロキシ(C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>)アルキル、-H<sub>2</sub>NC(=O)(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキル、-MeSO<sub>2</sub>NH(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)アルキルまたは2-(4-モルホリノ)エチルである、請求項1または2記載の化合物。

**【請求項 1 5】**

(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-(ビフェニル-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-(ビフェニル-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。