

【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30年10月25日(2018.10.25)

【公表番号】特表2017-526731(P2017-526731A)

【公表日】平成29年9月14日(2017.9.14)

【年通号数】公開・登録公報2017-035

【出願番号】特願2017-514515(P2017-514515)

【国際特許分類】

C 07 D	498/16	(2006.01)
A 61 K	31/5383	(2006.01)
A 61 P	1/04	(2006.01)
A 61 P	1/16	(2006.01)
A 61 P	3/10	(2006.01)
A 61 P	11/00	(2006.01)
A 61 P	11/02	(2006.01)
A 61 P	11/06	(2006.01)
A 61 P	17/00	(2006.01)
A 61 P	17/06	(2006.01)
A 61 P	17/04	(2006.01)
A 61 P	19/02	(2006.01)
A 61 P	21/04	(2006.01)
A 61 P	25/00	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	35/02	(2006.01)
A 61 P	37/02	(2006.01)
A 61 P	37/00	(2006.01)
A 61 P	37/08	(2006.01)
A 61 P	31/04	(2006.01)
A 61 P	31/12	(2006.01)
A 61 P	31/14	(2006.01)
A 61 P	31/20	(2006.01)
A 61 P	31/18	(2006.01)
A 61 P	31/22	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
C 07 D	519/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D	498/16	C S P
A 61 K	31/5383	
A 61 P	1/04	
A 61 P	1/16	
A 61 P	3/10	
A 61 P	11/00	
A 61 P	11/02	
A 61 P	11/06	
A 61 P	17/00	
A 61 P	17/06	
A 61 P	17/04	
A 61 P	19/02	
A 61 P	21/04	

A 6 1 P	25/00
A 6 1 P	35/00
A 6 1 P	35/02
A 6 1 P	37/02
A 6 1 P	37/00
A 6 1 P	37/08
A 6 1 P	31/04
A 6 1 P	31/12
A 6 1 P	31/14
A 6 1 P	31/20
A 6 1 P	31/18
A 6 1 P	31/22
A 6 1 P	43/00
C 0 7 D	519/00
	1 1 1
	3 0 1

【手続補正書】

【提出日】平成30年9月13日(2018.9.13)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

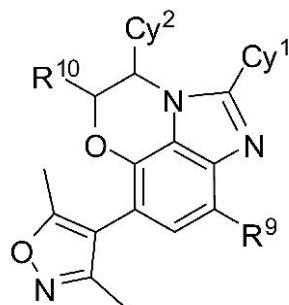
【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

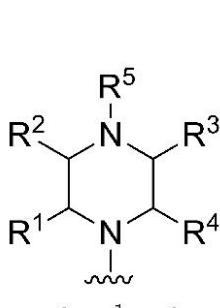
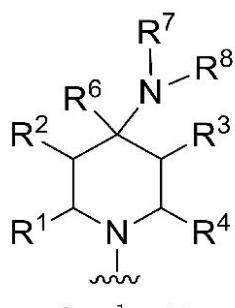
式 I :
【化1】

I

【式中】

Cy¹ は、式 Cy¹ - A または Cy¹ - B :

【化2】

Cy¹ - ACy¹ - B

で示される基であり；

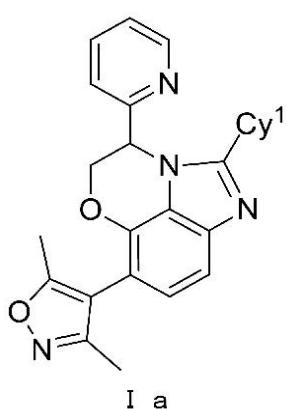
R¹、R²、R³、及びR⁴は、それぞれ独立して、H及びC₁~₄アルキルから選択

されるか；

または R^2 と R^4 が結合して $-CH_2-$ または $-CH_2CH_2-$ 架橋基を形成し；
 R^5 は、 $-C(=O)R^{5a}$ 、 $-C(=O)OR^{5a}$ 、 $-C(=O)NR^{5a}R^{5b}$ 、
 $-S(=O)_2R^{5a}$ 、または $-S(=O)_2NR^{5a}R^{5b}$ であり；
 R^{5a} は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ヒドロキシアルキル、
 $(C_{1-4}$ アルコキシ) $-C_{1-4}$ アルキル -、 C_{3-6} シクロアルキル、または C_{3-6}
 α シクロアルキル $-C_{1-4}$ アルキル - であり；
 R^{5b} は、H または C_{1-4} アルキルであり；
 R^6 は、H またはメチルであり；
 R^7 は、H、 C_{1-4} アルキル、 $-C(=O)R^{7a}$ 、 $-C(=O)OR^{7a}$ 、 $-C(=O)NR^{7a}R^{7b}$ 、
 $-S(=O)_2R^{7a}$ 、または $-S(=O)_2NR^{7a}R^{7b}$ であり；
 R^{7a} は C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ヒドロキシアルキル、 $(C_{1-4}$ アルコキシ) $-C_{1-4}$ アルキル -、 C_{3-6} シクロアルキル、または C_{3-6}
 β シクロアルキル $-C_{1-4}$ アルキル - であり；
 R^{7b} は、H または C_{1-4} アルキルであり；
 R^8 は、H またはメチルであり；
 Cy^2 は、ピリジン-2-イルまたはピリジン-3-イルであり、その各々は F または
 C_1 で置換されていてもよく、該 F 及び C_1 はピリジン窒素に対してメタまたはパラであり；
 R^9 は、H、F、または CH_2OH であり；ならびに、
 R^{10} は、H、 $-C(=O)NHCH_3$ 、 $-C(=O)NHCH_2CH_3$ 、 $-C(=O)NHC_2H_5$ 、
 $-C(=O)NHC_2CH_2CH_3$ 、または $-C(=O)NHCH(C_2H_5)_2$ であり；
ただし、
 i) R^{5a} が、メチル、エチルまたは i - プロピルである場合、 R^1 、 R^2 、 R^3 、及び R^4 のうちの一つは H 以外であり；
 ii) R^{7a} が、メチル、エチル、i - プロピル、 $-CF_3$ 、またはメトキシメチルである場合、 R^1 、 R^2 、 R^3 、及び R^4 のうちの一つは H 以外であり；ならびに、
 iii) R^7 及び R^8 が両方ともメチルである場合、 R^1 、 R^2 、 R^3 、及び R^4 のうちの一つは H 以外である。
 で示される化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 2】

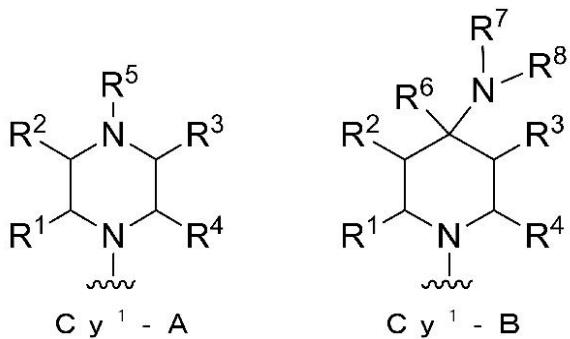
式 I a :
 【化 3】



〔式中：

Cy^1 は、式 $Cy^1 - A$ または $Cy^1 - B$:

【化4】



で示される基であり；

R^1 、 R^2 、 R^3 、及び R^4 は、それぞれ独立して、H及び C_{1-4} アルキルから選択されるか；

または R^2 と R^4 が結合して $-\text{CH}_2-$ または $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 架橋基を形成し；

R^5 は、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{5\text{a}}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{5\text{a}}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{5\text{a}}\text{R}^{5\text{b}}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^{5\text{a}}$ 、または $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^{5\text{a}}\text{R}^{5\text{b}}$ であり；

$\text{R}^{5\text{a}}$ は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ヒドロキシアルキル、(C_{1-4} アルコキシ)- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-6} シクロアルキル、または C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-であり；

$\text{R}^{5\text{b}}$ は、Hまたは C_{1-4} アルキルであり；

R^6 は、Hまたはメチルであり；

R^7 は、H、 C_{1-4} アルキル、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{7\text{a}}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{7\text{a}}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{7\text{a}}\text{R}^{7\text{b}}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^{7\text{a}}$ 、または $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^{7\text{a}}\text{R}^{7\text{b}}$ であり；

$\text{R}^{7\text{a}}$ は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ヒドロキシアルキル、(C_{1-4} アルコキシ)- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-6} シクロアルキル、または C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-であり；

$\text{R}^{7\text{b}}$ は、Hまたは C_{1-4} アルキルであり；ならびに、

R^8 は、Hまたはメチルであり；

ただし、

i) $\text{R}^{5\text{a}}$ が、メチル、エチルまたはi-プロピルである場合、 R^1 、 R^2 、 R^3 、及び R^4 のうちの一つはH以外であり；

ii) $\text{R}^{7\text{a}}$ が、メチル、エチル、i-プロピル、 $-\text{CF}_3$ 、またはメトキシメチルである場合、 R^1 、 R^2 、 R^3 、及び R^4 のうちの一つはH以外であり；ならびに、

iii) R^7 及び R^8 が両方ともメチルである場合、 R^1 、 R^2 、 R^3 、及び R^4 のうちの一つはH以外である】

で示される化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項3】

Cy^1 が、式 $\text{Cy}^1 - \text{A}$ で示される基であり；

R^1 、 R^2 、 R^3 、及び R^4 が、それぞれ独立して、H及びメチルから選択されるか；

または R^2 と R^4 が結合して $-\text{CH}_2-$ 架橋基を形成し；

R^5 が、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{5\text{a}}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{5\text{a}}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{5\text{a}}\text{R}^{5\text{b}}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^{5\text{a}}$ 、または $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^{5\text{a}}\text{R}^{5\text{b}}$ であり；

$\text{R}^{5\text{a}}$ が、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} ハロアルキル、 C_{1-4} ヒドロキシアルキル、(C_{1-4} アルコキシ)- C_{1-4} アルキル-、 C_{3-6} シクロアルキル、または C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-4} アルキル-であり；

$\text{R}^{5\text{b}}$ が、Hまたはメチルであり；

ただし、 $\text{R}^{5\text{a}}$ が、メチル、エチルまたはi-プロピルである場合、 R^1 、 R^2 、 R^3 、及び R^4 のうちの一つがH以外である、

請求項1もしくは2に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4】

C y¹ が、式 C y¹ - A で示される基であり；
R¹、R²、R³、及び R⁴ が、それぞれ独立して、H 及びメチルから選択されるか；
または R² と R⁴ が結合して -C H₂- 架橋基を形成し；
R⁵ が -C(=O)R^{5a} であり；ならびに、
R^{5a} が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、
s-ブチル、t-ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、モノフルオロメチル
、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、モノフルオロエチル、ヒドロキシエチル、メ
トキシメチル、メトキシエチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シク
ロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、また
はシクロヘキシルメチルである。

請求項 1～3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 5】

R⁵ が -C(=O)R^{5a} である、請求項 1～3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 6】

R^{5a} が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、
 s-ブチル、t-ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、モノフルオロメチル
 、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、モノフルオロエチル、ヒドロキシエチル、メ
 トキシメチル、メトキシエチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シク
 ロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、また
 はシクロヘキシルメチルである、請求項 1～3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその
 薬学的に許容可能な塩。

【請求項 7】

R^{5a} が、n-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、モノフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、モノフルオロエチル、ヒドロキシエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、またはシクロヘキシルメチルである、請求項 1～3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 8】

R^{5a} が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、
 s-ブチル、t-ブチル、メトキシメチル、メトキシエチル、シクロプロピル、シクロブチル、
 シクロペンチル、またはシクロヘキシルである、請求項 1～6 のいずれか一項に記載の
 化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 9】

R^{5a} が、n-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、メトキシメチル、
 メトキシエチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、またはシクロヘキシル
 である、請求項 1～6 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 10】

R^{5a} が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、t-ブチル、メトキシメチル、
 シクロプロピル、またはシクロブチルである、請求項 1～6 のいずれか一項に記載の
 化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 11】

R^{5a} が、n-プロピル、t-ブチル、メトキシメチル、シクロプロピル、またはシクロ
 ブチルである、請求項 1～6 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容
 可能な塩。

【請求項 12】

C y¹ が、式 C y¹ - B で示される基であり；

R¹、R²、R³、及びR⁴が、それぞれ独立して、H及びメチルから選択されるか；またはR²とR⁴が結合して-CH₂-架橋基を形成し；

R⁶が、Hまたはメチルであり；

R⁷が、H、C₁₋₄アルキル、-C(=O)R^{7a}、-C(=O)OR^{7a}、-C(=O)NR^{7a}R^{7b}、-S(=O)₂R^{7a}、または-S(=O)₂NR^{7a}R^{7b}であります；

R^{7a}が、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄ハロアルキル、C₁₋₄ヒドロキシアルキル、(C₁₋₄アルコキシ)-C₁₋₄アルキル-、C₃₋₆シクロアルキル、またはC₃₋₆シクロアルキル-C₁₋₄アルキル-であり；

R^{7b}が、Hまたはメチルであり；ならびに、

R⁸が、Hまたはメチルであり；

ただし、R^{7a}が、メチル、エチル、i-プロピル、-CF₃、またはメトキシメチルである場合、R¹、R²、R³、及びR⁴のうちの一つがH以外であり；ならびにR⁷及びR⁸が共にメチルである場合、R¹、R²、R³、及びR⁴のうちの一つがH以外である。

請求項1もしくは2に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項13】

Cy¹が、式Cy¹-Bで示される基であり；

R¹、R²、R³、及びR⁴が、それぞれ独立して、H及びメチルから選択されるか；またはR²とR⁴が結合して-CH₂-架橋基を形成し；

R⁶が、Hまたはメチルであり；

R⁷が、-C(=O)R^{7a}、-C(=O)NR^{7a}R^{7b}、または-S(=O)₂R^{7a}であります；

R^{7a}が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、モノフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、モノフルオロエチル、ヒドロキシエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、またはシクロヘキシルメチルであります；

R^{7b}が、Hまたはメチルであり；ならびに、

R⁸が、Hまたはメチルである。

請求項1もしくは2に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項14】

R⁷が-C(=O)R^{7a}、-C(=O)NR^{7a}R^{7b}、または-S(=O)₂R^{7a}であります、請求項1、2及び12のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項15】

R⁷が-C(=O)R^{7a}である、請求項1、2、12、及び13のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項16】

R^{7a}が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、モノフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、モノフルオロエチル、ヒドロキシエチル、メトキシメチル、メトキシエチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、またはシクロヘキシルメチルである、請求項1、2、12、14、及び15のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項17】

R^{7a}が、n-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、ジフルオロメチル、モノフルオロメチル、トリフルオロエチル、ジフルオロエチル、モノフルオロエチル、モ

ロエチル、ヒドロキシエチル、メトキシエチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、またはシクロヘキシルメチルである、請求項1、2、12、14、及び15のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項18】

R^{7a}が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、メトキシメチル、メトキシエチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、またはシクロヘキシルである、請求項1、2、及び12～15のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項19】

R^{7a}が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、t-ブチル、シクロプロピル、またはシクロブチルである、請求項1、2、及び12～15のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項20】

R^{7a}がシクロプロピルである、請求項1、2、及び12～15のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項21】

R^{7a}がシクロブチルである、請求項1、2、及び12～15のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項22】

R⁶がHである、請求項1、2、及び12～21のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項23】

R⁶がメチルである、請求項1、2、及び12～21のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項24】

R^{7b}がHである、請求項1～14、及び16～23のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項25】

R^{7b}がメチルである、請求項1～14、及び16～23のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項26】

R¹、R²、R³、及びR⁴がそれぞれ独立してH及びメチルから選択されるか、またはR²とR⁴が結合して-C H₂-架橋基を形成する、請求項1～25のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項27】

R¹、R²、R³、及びR⁴がそれぞれ独立してH及びメチルから選択される、請求項1～25のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項28】

R¹、R²、R³、及びR⁴の各々がHである、請求項1～25のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項29】

R⁹がHである、請求項1～28のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項30】

R¹⁰がHである、請求項1～29のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項31】

Cy²が、FまたはC1で置換されていてよいピリジン-2-イルであり、該F及びC1がピリジン窒素に対してメタまたはパラである、請求項1、及び3～30のいずれか

一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 3 2】

Cy²がピリジン-2-イルである、請求項1及び3~30のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 3 3】

以下から選択される請求項1に記載の化合物：

(4S)-7-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)-2-(4-イソブチリルピペラジン-1-イル)-4-ピリジン-2-イル-4,5-ジヒドロイミダゾ[1,5,4-de][1,4]ベンゾキサジン；

(4S)-2-[(2R,6S)-4-アセチル-2,6-ジメチルピペラジン-1-イル]-7-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)-4-ピリジン-2-イル-4,5-ジヒドロイミダゾ[1,5,4-de][1,4]ベンゾキサジン；

(4S)-2-[(2S)-4-アセチル-2-メチルピペラジン-1-イル]-7-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)-4-ピリジン-2-イル-4,5-ジヒドロイミダゾ[1,5,4-de][1,4]ベンゾキサジン；

(4S)-2-(5-アセチル-2,5-ジアザビシクロ[2.2.1]ヘプト-2-イル)-7-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)-4-ピリジン-2-イル-4,5-ジヒドロイミダゾ[1,5,4-de][1,4]ベンゾキサジン；

N-{1-[(4S)-7-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)-4-ピリジン-2-イル-4,5-ジヒドロイミダゾ[1,5,4-de][1,4]ベンゾキサジン-2-イル]-4-メチルピペリジン-4-イル}アセトアミド；

N-{1-[(4S)-7-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)-4-ピリジン-2-イル-4,5-ジヒドロイミダゾ[1,5,4-de][1,4]ベンゾキサジン-2-イル]ピペリジン-4-イル}-N-メチルアセトアミド；

(4S)-2-[(3S)-4-アセチル-3-メチルピペラジン-1-イル]-7-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)-4-ピリジン-2-イル-4,5-ジヒドロイミダゾ[1,5,4-de][1,4]ベンゾキサジン；

(4S)-7-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)-2-[(3S)-3-メチル-4-プロピオニルピペラジン-1-イル]-4-ピリジン-2-イル-4,5-ジヒドロイミダゾ[1,5,4-de][1,4]ベンゾキサジン；

(4S)-7-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)-2-[(3S)-4-イソブチリル-3-メチルピペラジン-1-イル]-4-ピリジン-2-イル-4,5-ジヒドロイミダゾ[1,5,4-de][1,4]ベンゾキサジン；

N-{1-[(4S)-7-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)-4-ピリジン-2-イル-4,5-ジヒドロイミダゾ[1,5,4-de][1,4]ベンゾキサジン-2-イル]ピペリジン-4-イル}ブタンアミド；

N-{1-[(4S)-7-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)-4-ピリジン-2-イル-4,5-ジヒドロイミダゾ[1,5,4-de][1,4]ベンゾキサジン-2-イル]ピペリジン-4-イル}-2,2-ジメチルプロパンアミド；

N-{1-[(4S)-7-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)-4-ピリジン-2-イル-4,5-ジヒドロイミダゾ[1,5,4-de][1,4]ベンゾキサジン-2-イル]ピペリジン-4-イル}シクロプロパンカルボキサミド；

N-{1-[(4S)-7-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)-4-ピリジン-2-イル-4,5-ジヒドロイミダゾ[1,5,4-de][1,4]ベンゾキサジン-2-イル]ピペリジン-4-イル}シクロブタンカルボキサミド；

N-{1-[(4S)-7-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)-4-ピリジン-2-イル-4,5-ジヒドロイミダゾ[1,5,4-de][1,4]ベンゾキサジン-2-イル]ピペリジン-4-イル}エタンスルホンアミド；

N-{1-[(4S)-7-(3,5-ジメチルイソキサゾール-4-イル)-4-ピリジン-2-イル-4,5-ジヒドロイミダゾ[1,5,4-de][1,4]ベンゾキ

サジン - 2 - イル] ピペリジン - 4 - イル } - N - メチルプロパンアミド ;

N - { 1 - [(4 S) - 7 - (3 , 5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - イル) - 4 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 - ジヒドロイミダゾ [1 , 5 , 4 - d e] [1 , 4] ベンゾキサジン - 2 - イル] ピペリジン - 4 - イル } - N - メチルブタンアミド ;

N - { 1 - [(4 S) - 7 - (3 , 5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - イル) - 4 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 - ジヒドロイミダゾ [1 , 5 , 4 - d e] [1 , 4] ベンゾキサジン - 2 - イル] ピペリジン - 4 - イル } - N , 2 - ジメチルプロパンアミド ;

N - { 1 - [(4 S) - 7 - (3 , 5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - イル) - 4 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 - ジヒドロイミダゾ [1 , 5 , 4 - d e] [1 , 4] ベンゾキサジン - 2 - イル] ピペリジン - 4 - イル } - N , 2 , 2 - トリメチルプロパンアミド ;

N - { 1 - [(4 S) - 7 - (3 , 5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - イル) - 4 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 - ジヒドロイミダゾ [1 , 5 , 4 - d e] [1 , 4] ベンゾキサジン - 2 - イル] ピペリジン - 4 - イル } - N - メチルシクロプロパンカルボキサミド ;

N - { 1 - [(4 S) - 7 - (3 , 5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - イル) - 4 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 - ジヒドロイミダゾ [1 , 5 , 4 - d e] [1 , 4] ベンゾキサジン - 2 - イル] ピペリジン - 4 - イル } - N - メチルシクロブタンカルボキサミド ;

N - { 1 - [(4 S) - 7 - (3 , 5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - イル) - 4 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 - ジヒドロイミダゾ [1 , 5 , 4 - d e] [1 , 4] ベンゾキサジン - 2 - イル] ピペリジン - 4 - イル } - N , N ' , N ' - トリメチル尿素 ;

N - { 1 - [(4 S) - 7 - (3 , 5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - イル) - 4 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 - ジヒドロイミダゾ [1 , 5 , 4 - d e] [1 , 4] ベンゾキサジン - 2 - イル] ピペリジン - 4 - イル } - N - メチルメタンスルホンアミド ;

N - { 1 - [(4 S) - 7 - (3 , 5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - イル) - 4 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 - ジヒドロイミダゾ [1 , 5 , 4 - d e] [1 , 4] ベンゾキサジン - 2 - イル] ピペリジン - 4 - イル } - N - メチルエタンスルホンアミド ;

N - { 1 - [(4 S) - 7 - (3 , 5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - イル) - 4 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 - ジヒドロイミダゾ [1 , 5 , 4 - d e] [1 , 4] ベンゾキサジン - 2 - イル] ピペリジン - 4 - イル } - N - メチルシクロプロパンスルホンアミド ;

(4 S) - 2 - (4 - ブチリルピペラジン - 1 - イル) - 7 - (3 , 5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - イル) - 4 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 - ジヒドロイミダゾ [1 , 5 , 4 - d e] [1 , 4] ベンゾキサジン ;

(4 S) - 7 - (3 , 5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - イル) - 2 - [4 - (2 , 2 - ジメチルプロパノイル) ピペラジン - 1 - イル] - 4 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 - ジヒドロイミダゾ [1 , 5 , 4 - d e] [1 , 4] ベンゾキサジン ;

(4 S) - 2 - [4 - (シクロプロピルカルボニル) ピペラジン - 1 - イル] - 7 - (3 , 5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - イル) - 4 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 - ジヒドロイミダゾ [1 , 5 , 4 - d e] [1 , 4] ベンゾキサジン ;

(4 S) - 2 - [4 - (シクロブチルカルボニル) ピペラジン - 1 - イル] - 7 - (3 , 5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - イル) - 4 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 - ジヒドロイミダゾ [1 , 5 , 4 - d e] [1 , 4] ベンゾキサジン ;

(4 S) - 7 - (3 , 5 - ジメチルイソキサゾール - 4 - イル) - 2 - [4 - (メトキシアセチル) ピペラジン - 1 - イル] - 4 - ピリジン - 2 - イル - 4 , 5 - ジヒドロイミダゾ [1 , 5 , 4 - d e] [1 , 4] ベンゾキサジン ;

または上記のいずれかの薬学的に許容可能な塩。

【請求項 3 4】

請求項 1 ~ 3 3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、及び少なくとも 1 つの薬学的に許容可能な担体を含む、医薬組成物。

【請求項 3 5】

B E T タンパク質阻害用医薬であって、請求項 1 ~ 3 3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩を含む、医薬。

【請求項 3 6】

B E T タンパク質に関連する疾患または症状治療用医薬であって、請求項 1 ~ 3 3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩を含む、医薬。

【請求項 3 7】

増殖性障害治療用医薬であって、請求項 1 ~ 3 3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩を含む、医薬。

【請求項 3 8】

増殖性障害が癌である、請求項 3 7 に記載の医薬。

【請求項 3 9】

癌が、腺癌、膀胱癌、芽細胞腫、骨癌、乳癌、脳癌、癌腫、骨髄肉腫、子宮頸癌、結腸直腸癌、食道癌、胃腸癌、多形神経膠芽腫、神経膠腫、胆嚢癌、胃癌、頭頸部癌、ホジキンリンパ腫、非ホジキンリンパ腫、腸癌、腎癌、喉頭癌、白血病、肺癌、リンパ腫、肝臓癌、小細胞肺癌、非小細胞肺癌、中皮腫、多発性骨髄腫、眼癌、視神経腫瘍、口腔癌、卵巣癌、下垂体腫瘍、原発性中枢神経系リンパ腫、前立腺癌、腋臓癌、咽頭癌、腎細胞癌、直腸癌、肉腫、皮膚癌、脊髄腫瘍、小腸癌、胃癌、T 細胞白血病、T 細胞リンパ腫、精巣癌、甲状腺癌、咽喉癌、泌尿生殖器癌、尿路上皮癌、子宮癌、腫瘍、またはウィルムス腫瘍である、請求項 3 8 に記載の医薬。

【請求項 4 0】

増殖性障害が非癌性増殖性障害である、請求項 3 7 に記載の医薬。

【請求項 4 1】

自己免疫疾患または炎症性疾患治療用医薬であって、請求項 1 ~ 3 3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩を含む、医薬。

【請求項 4 2】

自己免疫疾患または炎症性疾患が、アレルギー、アレルギー性鼻炎、関節炎、喘息、慢性閉塞性肺疾患、変性関節疾患、皮膚炎、器官拒絶反応、湿疹、肝炎、炎症性腸疾患、多発性硬化症、重症筋無力症、乾癬、敗血症、敗血症症候群、敗血症性ショック、全身性エリテマトーデス、組織移植片拒絶、I 型糖尿病から選択される、請求項 4 1 に記載の医薬。

【請求項 4 3】

ウイルス感染治療用医薬であって、請求項 1 ~ 3 3 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩を含む、医薬。

【請求項 4 4】

ウイルス感染が、アデノウイルス、エプスタイン・バーウィルス、B 型肝炎ウイルス、C 型肝炎ウイルス、ヘルペスウイルス、ヒト免疫不全ウイルス、ヒトパピローマウイルスまたはポックスウイルスによる感染である、請求項 4 3 に記載の医薬。