

【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	1 1 1
C 0 7 D	519/00	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

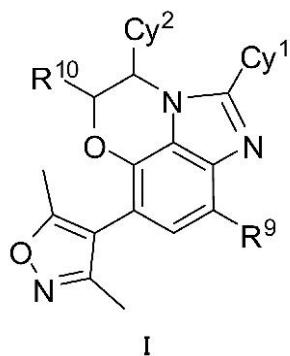
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I :

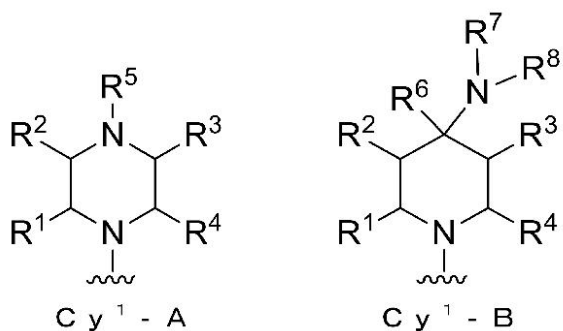
【化1】



[式中 :

Cy¹ は、式 Cy¹ - A または Cy¹ - B :

【化2】



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} 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} 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 F または Cl で置換されていてもよく、該 F 及び Cl はピリジン窒素に対してメタまたはパラである；

R^9 は、H、F、または CH_2OH であり；ならびに、

R^{10} は、H、 $-C(=O)NHCH_3$ 、 $-C(=O)NHCH_2CH_3$ 、 $-C(=O)NHCH_2CH_2CH_3$ 、または $-C(=O)NHCH(CH_3)_2$ 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、

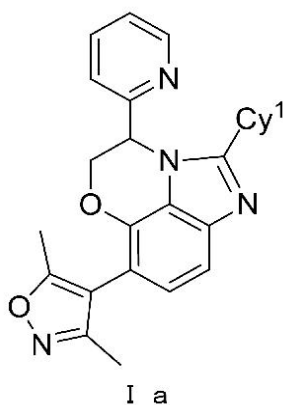
iii) R^7 及び R^8 が両方ともメチルである場合、 R^1 、 R^2 、 R^3 、及び R^4 のうちの一つは H 以外である]

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：

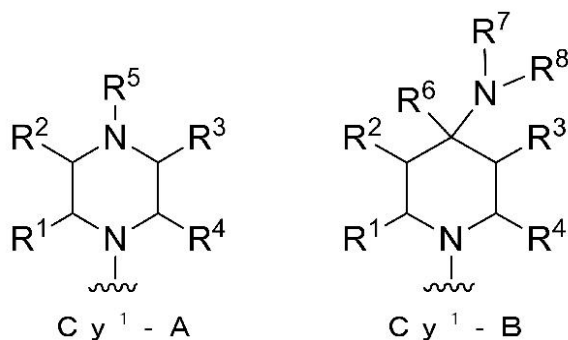
【化 3】



[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、 $-\text{C}(=\text{O})R^{5a}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{5a}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{5a}R^{5b}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2R^{5a}$ 、または $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^{5a}R^{5b}$ 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、 $(C_{1-4}\text{アルコキシ})-C_{1-4}$ 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；

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、 $-\text{C}(=\text{O})R^{7a}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{7a}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{7a}R^{7b}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2R^{7a}$ 、または $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^{7a}R^{7b}$ 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、 $(C_{1-4}\text{アルコキシ})-C_{1-4}$ 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；

R^{7b} 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) 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、 $-\text{CF}_3$ 、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、 $-\text{C}(=\text{O})R^{5a}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^{5a}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{5a}R^{5b}$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2R^{5a}$ 、または $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^{5a}R^{5b}$ であり；

R^{5a} 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、 $(C_{1-4}\text{アルコキシ})-C_{1-4}$ 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；

R^{5b} が、Hまたはメチルであり；

ただし、 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 -CH₂ - 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；

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 $-CH_2-$ 架橋基を形成し；
 R^6 が、Hまたはメチルであり；
 R^7 が、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} 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；
 R^{7b} が、Hまたはメチルであり；ならびに、
 R^8 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、 $-CF_3$ 、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 のうちの一つがH以外であり；ならびに R^7 及び R^8 が共にメチルである場合、 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13】

Cy^1 が、式 Cy^1-B 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 $-CH_2-$ 架橋基を形成し；
 R^6 が、Hまたはメチルであり；
 R^7 が、 $-C(=O)R^{7a}$ 、 $-C(=O)NR^{7a}R^{7b}$ 、または $-S(=O)_2R^{7a}$ であり；
 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；
 R^{7b} が、Hまたはメチルであり；ならびに、
 R^8 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】

R^7 が $-C(=O)R^{7a}$ 、 $-C(=O)NR^{7a}R^{7b}$ 、または $-S(=O)_2R^{7a}$ である、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】

R^7 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、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】

R^6 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】

R^6 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】

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 -CH₂- 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】

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、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】

R^1 、 R^2 、 R^3 、及び R^4 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】

R^9 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】

R^{10} 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】

Cy^2 が、F または C1 で置換されていてもよいピリジン-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、膵臓癌、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、陰癌、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・バーウイルス、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。