

【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7月5日(2018.7.5)

【公表番号】特表2017-519740(P2017-519740A)

【公表日】平成29年7月20日(2017.7.20)

【年通号数】公開・登録公報2017-027

【出願番号】特願2016-569825(P2016-569825)

【国際特許分類】

C 07 K 7/02 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 K 38/08 (2006.01)

A 61 K 38/07 (2006.01)

【F I】

C 07 K 7/02

A 61 P 35/00

A 61 K 38/08

A 61 K 38/07

【手続補正書】

【提出日】平成30年5月25日(2018.5.25)

【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

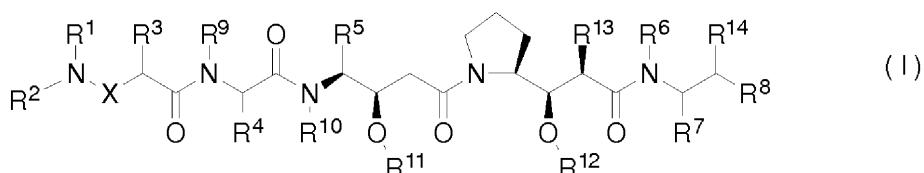
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物、または薬学的に許容されるその塩：



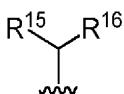
式中、

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>はそれぞれ独立して-Hまたはアルキルであり；

Xは-O-、-NR<sup>z</sup>-、-S-であるか、または存在せず；

ここでR<sup>z</sup>は-Hまたはアルキルであり；

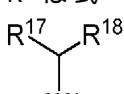
R<sup>3</sup>は式



の基であり；

ここでR<sup>15</sup>およびR<sup>16</sup>はそれぞれ独立して-H、-OH、-NH<sub>2</sub>、-SH、-N<sub>3</sub>、アルキル、アルケニル、アルキニル、-アルキル-OH、-アルキル-NH<sub>2</sub>、-アルキル-SH、または-アルキル-N<sub>3</sub>であり；

R<sup>4</sup>は式



の基であり；

ここでR<sup>17</sup>は-H、-OH、-NH<sub>2</sub>、-SH、-N<sub>3</sub>、-CO<sub>2</sub>H、アルケニル、アルキニル、-アルキル-OH、-アルキル-NH<sub>2</sub>、-アルキル-SH、-アルキル-N<sub>3</sub>、または-アルキル-CO<sub>2</sub>Hであり；R<sup>18</sup>は-H、-OH、-NH<sub>2</sub>、-SH、-N<sub>3</sub>、-CO<sub>2</sub>H、アルキル、アルケニル、アルキニル、-アルキル-OH、-アルキル-NH<sub>2</sub>、-アルキル-SH、-アルキル-N<sub>3</sub>、または-アルキル-CO<sub>2</sub>Hであり；

R<sup>5</sup>はsec- プチルまたはイソブチルであり；

R<sup>6</sup>は-Hまたはアルキルであり；

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>はそれぞれ独立して-H、アルキル、-CO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、CONR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>、置換もしくは非置換フェニル、または置換もしくは非置換複素環であり；

ここでR<sup>a</sup>は-Hまたはアルキルであり；

R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>はそれぞれ独立してHまたはアルキルであり；

R<sup>9</sup>は-Hまたはアルキルであり；あるいは、R<sup>9</sup>はR<sup>4</sup>およびそれらが結合している原子と一緒にになって置換または非置換ヘテロシクロアルキル環を形成し；

R<sup>10</sup>は-Hまたはアルキルであり；

R<sup>11</sup>は-Hまたはアルキルであり；

R<sup>12</sup>は-Hまたはアルキルであり；

R<sup>13</sup>は-Hまたはアルキルであり；

R<sup>14</sup>は-H、-OH、またはアルキルであり、

但し、Xが存在せず、R<sup>15</sup>、R<sup>16</sup>、R<sup>17</sup>、およびR<sup>18</sup>がそれぞれメチルである場合、R<sup>8</sup>は置換もしくは非置換フェニル、または置換もしくは非置換複素環ではない。

#### 【請求項 2】

Xが存在しない、請求項1記載の化合物。

#### 【請求項 3】

R<sup>15</sup>およびR<sup>16</sup>がそれぞれ独立して-Hまたはアルキルであり；

R<sup>7</sup>が-H、-CO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、-CONR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>、または置換もしくは非置換複素環であり；

R<sup>8</sup>が置換もしくは非置換フェニル、または置換もしくは非置換複素環であり；

R<sup>14</sup>が-Hである、

請求項2記載の化合物。

#### 【請求項 4】

R<sup>15</sup>およびR<sup>16</sup>がそれぞれメチルである、請求項3記載の化合物。

#### 【請求項 5】

R<sup>17</sup>が-OH、-NH<sub>2</sub>、-SH、または-N<sub>3</sub>であり；

R<sup>18</sup>は-Hまたはアルキルである、

請求項4記載の化合物。

#### 【請求項 6】

R<sup>7</sup>が-H、-CO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、または-CONR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>であり；

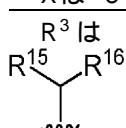
R<sup>8</sup>がフェニルである、

請求項5記載の化合物。

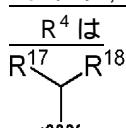
#### 【請求項 7】

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>はそれぞれ独立して-HまたはC<sub>1～6</sub>アルキルであり；

Xは-O-であるかまたは存在せず；



であり；ここでR<sup>15</sup>およびR<sup>16</sup>はそれぞれ独立して-H、-OH、またはC<sub>1～6</sub>アルキルであり；



であり；ここでR<sup>17</sup>は-OH、-NH<sub>2</sub>、-SH、-N<sub>3</sub>、-CO<sub>2</sub>H、-C<sub>1～6</sub>アルキル-NH<sub>2</sub>、アルキニル、アルケニル、または-C<sub>1～6</sub>アルキル-N<sub>3</sub>であり；R<sup>18</sup>は-HまたはC<sub>1～6</sub>アルキルであり；R<sup>5</sup>はsec-ブチルであり；

R<sup>6</sup>は-Hであり；

R<sup>7</sup>は-H、C<sub>1～6</sub>アルキル、-CO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、-CONR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>、テトラゾリル、またはチアゾリルであり；ここでR<sup>a</sup>は-HまたはC<sub>1～6</sub>アルキルであり；R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>はそれぞれ-HまたはC<sub>1～6</sub>アルキルであり；

R<sup>8</sup>は-H、C<sub>1～6</sub>アルキル、置換もしくは非置換フェニル、または置換もしくは非置換複素環であり；

R<sup>9</sup>は-Hであり；

R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、およびR<sup>13</sup>はそれぞれ独立してC<sub>1～6</sub>アルキルであり；

R<sup>14</sup>は-H、C<sub>1～6</sub>アルキル、または-OHである。

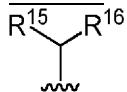
請求項1記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩。

#### 【請求項8】

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>はそれぞれ独立して-Hまたはメチルであり；

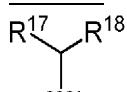
Xは-O-であるかまたは存在せず；

R<sup>3</sup>は



であり；ここでR<sup>15</sup>およびR<sup>16</sup>はそれぞれ独立して-H、-OH、またはメチルであり；

R<sup>4</sup>は



であり；ここでR<sup>17</sup>は-OH、-NH<sub>2</sub>、-SH、-N<sub>3</sub>、-CO<sub>2</sub>H、アミノメチル、アルキニル、アルケニル、またはアジドメチルであり；R<sup>18</sup>は-Hまたはメチルであり；

R<sup>5</sup>はsec-ブチルであり；

R<sup>6</sup>は-Hであり；

R<sup>7</sup>は-H、メチル、-CO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、または-CONR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>であり；ここでR<sup>a</sup>は-Hまたはメチルであり；R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>はそれぞれ独立して-Hまたはメチルであり；

R<sup>8</sup>は-H、メチル、エチル、ピリジニル、ピペリジニル、非置換フェニル、ハロで置換されたフェニルであり；

R<sup>9</sup>は-Hであり；

R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、およびR<sup>13</sup>はそれぞれメチルであり；

R<sup>14</sup>は-H、メチル、または-OHである。

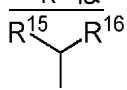
請求項1記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩。

#### 【請求項9】

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>はそれぞれ独立して-HまたはC<sub>1～6</sub>アルキルであり；

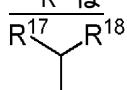
Xは存在せず；

R<sup>3</sup>は



であり；ここでR<sup>15</sup>およびR<sup>16</sup>はそれぞれ独立して-H、-OH、またはC<sub>1～6</sub>アルキルであり；

R<sup>4</sup>は



であり；ここでR<sup>17</sup>は-N<sub>3</sub>であり、R<sup>18</sup>は-Hまたはメチルであり；

R<sup>5</sup>はsec-ブチルであり；

R<sup>6</sup>は-Hであり；

R<sup>7</sup>は-H、C<sub>1～6</sub>アルキル、-CO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、-CONR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>、テトラゾリル、またはチアゾリルであり；

ここでR<sup>a</sup>は-HまたはC<sub>1～6</sub>アルキルであり；R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>はそれぞれ独立して-HまたはC<sub>1～6</sub>アルキルであり；

R<sup>8</sup>は-H、C<sub>1～6</sub>アルキル、置換もしくは非置換フェニル、または置換もしくは非置換複素環であり；

R<sup>9</sup>は-Hであり；

R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、およびR<sup>13</sup>はそれぞれ独立してC<sub>1～6</sub>アルキルであり；

R<sup>14</sup>は-H、C<sub>1～6</sub>アルキル、または-OHである、

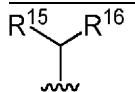
請求項1記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩。

**【請求項10】**

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>はそれぞれメチルであり；

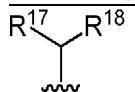
Xは存在せず；

R<sup>3</sup>は式



の基であり；ここでR<sup>15</sup>およびR<sup>16</sup>はそれぞれメチルであり；

R<sup>4</sup>は式



の基であり；ここでR<sup>17</sup>は-N<sub>3</sub>、-NH<sub>2</sub>、-OH、-SHであり、R<sup>18</sup>は-Hまたはメチルであり；

R<sup>5</sup>はsec-ブチルであり；

R<sup>6</sup>は-Hであり；

R<sup>7</sup>は-CO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>またはCONR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>であり、

ここでR<sup>a</sup>は-HまたはC<sub>1～6</sub>アルキルであり；R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>はそれぞれ独立してHまたはC<sub>1～6</sub>アルキルであり；

R<sup>8</sup>はフェニルであり；

R<sup>9</sup>は-Hであり；

R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、およびR<sup>13</sup>はそれぞれ独立してメチルであり；

R<sup>14</sup>は-Hである、

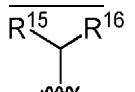
請求項1記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩。

**【請求項11】**

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>はそれぞれ独立して-HまたはC<sub>1～6</sub>アルキルであり；

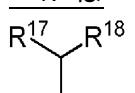
Xは存在せず；

R<sup>3</sup>は



であり；ここでR<sup>15</sup>およびR<sup>16</sup>はそれぞれ独立して-H、-OH、またはC<sub>1～6</sub>アルキルであり；

R<sup>4</sup>は



であり；ここでR<sup>17</sup>は-N<sub>3</sub>であり、R<sup>18</sup>は-HまたはC<sub>1～6</sub>アルキルであり；

R<sup>5</sup>はsec-ブチルであり；

R<sup>6</sup>は-Hであり；

R<sup>7</sup>はC<sub>1～6</sub>アルキル、-CONR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>、テトラゾリル、またはチアゾリルであり；R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>

はそれぞれ独立して-HまたはC<sub>1~6</sub>アルキルであり；

R<sup>8</sup>は-H、C<sub>1~6</sub>アルキル、置換もしくは非置換フェニル、または置換もしくは非置換複素環であり；

R<sup>9</sup>は-Hであり；

R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、およびR<sup>13</sup>はそれぞれ独立してC<sub>1~6</sub>アルキルであり；

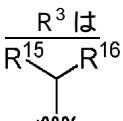
R<sup>14</sup>は-H、C<sub>1~6</sub>アルキル、または-OHである、

請求項1記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩。

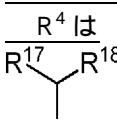
【請求項12】

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>はそれぞれ独立して-HまたはC<sub>1~6</sub>アルキルであり；

Xは存在せず；



であり；ここでR<sup>15</sup>およびR<sup>16</sup>はそれぞれ独立して-H、-OH、またはC<sub>1~6</sub>アルキルであり；



であり；ここでR<sup>17</sup>は-N<sub>3</sub>であり、R<sup>18</sup>は-HまたはC<sub>1~6</sub>アルキルであり；

R<sup>5</sup>はsec-ブチルであり；

R<sup>6</sup>は-Hであり；

R<sup>7</sup>は-CONR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>であり；R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>はそれぞれ独立して-HまたはC<sub>1~6</sub>アルキルであり；

R<sup>8</sup>は-H、C<sub>1~6</sub>アルキル、置換もしくは非置換フェニル、または置換もしくは非置換複素環であり；

R<sup>9</sup>は-Hであり；

R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、およびR<sup>13</sup>はそれぞれ独立してC<sub>1~6</sub>アルキルであり；

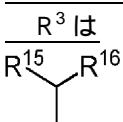
R<sup>14</sup>は-H、C<sub>1~6</sub>アルキル、または-OHである、

請求項1記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩。

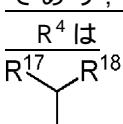
【請求項13】

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>はそれぞれ独立して-Hまたはメチルであり；

Xは存在せず；



であり；ここでR<sup>15</sup>およびR<sup>16</sup>はそれぞれ独立して-H、-OH、またはメチルであり；



であり；ここでR<sup>17</sup>は-N<sub>3</sub>であり、R<sup>18</sup>は-Hまたはメチルであり；

R<sup>5</sup>はsec-ブチルであり；

R<sup>6</sup>は-Hであり；

R<sup>7</sup>は-CONR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>であり；R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>はそれぞれ独立して-Hまたはメチルであり；

R<sup>8</sup>はフェニルであり；

R<sup>9</sup>は-Hであり；

R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、およびR<sup>13</sup>はそれぞれ独立してメチルであり；

R<sup>14</sup>は-H、メチル、または-OHである、

請求項1記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩。

## 【請求項 1 4】

以下からなる群より選択される化合物、または薬学的に許容されるその塩：

- (S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-ヒドロキシ-N-メチルプロパンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート；
- (S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3R)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-ヒドロキシ-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート；
- (S)-2-(ジメチルアミノ)-N-((S)-3-ヒドロキシ-1-(((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)(メチル)アミノ)-1-オキソプロパン-2-イル)-3-メチルブタンアミド；
- (2S,3R)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-ヒドロキシ-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；
- (2S)-2-(ジメチルアミノ)-N-((2S)-3-ヒドロキシ-1-(((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((2S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ピペリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)(メチル)アミノ)-1-オキソプロパン-2-イル)-3-メチルブタンアミド；
- (2S,3R)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-ヒドロキシ-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((2S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ピペリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；
- (S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート；
- (S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-3-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルプロパンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート；
- (S)-N-((S)-3-アミノ-1-(((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)(メチル)アミノ)-1-オキソプロパン-2-イル)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド；
- (S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルプロパンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート；
- (S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-4-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート；
- (S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-4-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート；

(S)-2-((S)-2-(アミノオキシ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N,3-ジメチルブタンアミド；

((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシプロパンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニン；

((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((2S,3R)-2-((ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシブタンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニン；

(S)-2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパン酸；

(S)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((2S,3R)-2-((ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシブタンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド；

(S)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシブタンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド；

(S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((R)-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-メルカプト-N-メチルプロパンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパンエート；

(S)-2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((R)-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-メルカプト-N-メチルプロパンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパン酸；

(S)-2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-ヒドロキシ-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパン酸；

(S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシプロパンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパンエート；

(S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((2S,3R)-2-((ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシブタンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパンエート；

(S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパンエート；

(S)-2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパン酸；

(2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-

- メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-(フェネチルアミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；  
(2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((1S,2R)-1-ヒドロキシ-1-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；  
(2S,3S)-3-アジド-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-((4-クロロフェネチル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド；  
(2S,3S)-3-アジド-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-((2-クロロフェネチル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド；  
(2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-1-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-(フェネチルアミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；  
(2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((1S,2R)-1-ヒドロキシ-1-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；  
(2S,3S)-3-アミノ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-((4-クロロフェネチル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド；  
(2S,3S)-3-アミノ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-((2-クロロフェネチル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド；  
(S)-4-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-(フェネチルアミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；  
(S)-4-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((1S,2R)-1-ヒドロキシ-1-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；  
(S)-4-アミノ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-((4-クロロフェネチル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド；  
(S)-4-アミノ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-((2-クロロフェネチル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド；  
メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルペンタ-4-インアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット；  
(2S,3S)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロ

パン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ))-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド；  
(2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ))-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；  
(2S,3S)-3-アジド-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-(tert-ブチルアミノ)-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ))-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド；  
メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-バリネット；  
メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-6-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルヘキサンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット；  
メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,4S)-4-アジド-1-(ジメチル-L-バリル)-N-メチルピロリジン-2-カルボキサミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット；  
(S)-3-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-4-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-3-((S)-1-メトキシ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)(メチル)アミノ)-4-オキソブタン酸；  
(2S,3R)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ))-3-メチルブタンアミド)-3-ヒドロキシ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((1S,2R)-1-ヒドロキシ-1-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；  
メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-セリネット；  
メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-イソロイシネット；  
(2S,3S)-3-アミノ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ))-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド；  
(2S,3S)-3-アミノ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-(tert-ブチルアミノ)-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ))-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド；  
メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-3-アジド-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)プロパンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット；  
メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)ブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット；  
(2S,3S)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メ

トキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-3-アジド-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)ブタンアミド；  
 ((2S,3S)-3-アジド-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-(tert-ブチルアミノ)-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロビル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)ブタンアミド；  
 tert-ブチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)ブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット；  
 ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)ブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニン；  
 tert-ブチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット；  
 (2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((S)-2-フェニル-1-(1H-テトラゾール-5-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；  
 (2S,3S)-3-アジド-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((S)-2-フェニル-1-(1H-テトラゾール-5-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；  
 (2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((S)-2-フェニル-1-(1H-テトラゾール-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；  
 tert-ブチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット；  
 (2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((S)-2-フェニル-1-(1H-テトラゾール-5-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド； および  
 (2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((S)-2-フェニル-1-(1H-テトラゾール-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド。

### 【請求項 15】

以下からなる群より選択される化合物、または薬学的に許容されるその塩：  
 (S)-2-((S)-2-(アミノオキシ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N,3-ジメチルブタンアミド；  
 ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシプロパンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニン；  
 ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((2S,3R)-2-(ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシブタンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニン；

(S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシプロパンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート； および

(S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((2S,3R)-2-(ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシブタンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート。

### 【請求項 16】

以下からなる群より選択される化合物、または薬学的に許容されるその塩：

(2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((1S,2R)-1-ヒドロキシ-1-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；

(2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((1S,2R)-1-ヒドロキシ-1-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；

(2S,3S)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド；

(2S,3S)-3-アジド-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；

(2S,3R)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-ヒドロキシ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((1S,2R)-1-ヒドロキシ-1-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；

(2S,3S)-3-アミノ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド；

(2S,3S)-3-アミノ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド；

(2S,3S)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-3-アジド-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)ブタンアミド；

((2S,3S)-3-アジド-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)ブタンアミド；

(2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-(((S)-2-フェニル-1-ヒテトラゾール-5-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；

(2S,3S)-3-アジド-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-(((S)-2-フェニル-1-(1H-テトラゾール-5-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)ブタンアミド；

(2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-(((S)-2-フェニル-1-(チアゾール-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；

(2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-(((S)-2-フェニル-1-(1H-テトラゾール-5-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；および

(2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-(((S)-2-フェニル-1-(チアゾール-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド。

#### 【請求項 17】

以下からなる群より選択される化合物、または薬学的に許容されるその塩：

(2S,3S)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド；

(2S,3S)-3-アジド-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-(tert-ブチルアミノ)-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド；

(2S,3S)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-3-アジド-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)ブタンアミド；および

((2S,3S)-3-アジド-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-(tert-ブチルアミノ)-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)ブタンアミド。

#### 【請求項 18】

(2S,3S)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-3-アジド-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)ブタンアミドの化合物、または薬学的に許容されるその塩。

#### 【請求項 19】

有効量の請求項1~18のいずれか一項記載の化合物または薬学的に許容されるその塩と、薬学的に許容される賦形剤とを含む、薬学的組成物。

#### 【請求項 20】

有効量の請求項1~18のいずれか一項記載の化合物または薬学的に許容されるその塩を含む、そのような処置を必要とする対象におけるがんを処置するための薬学的組成物。

#### 【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 5

【補正方法】変更

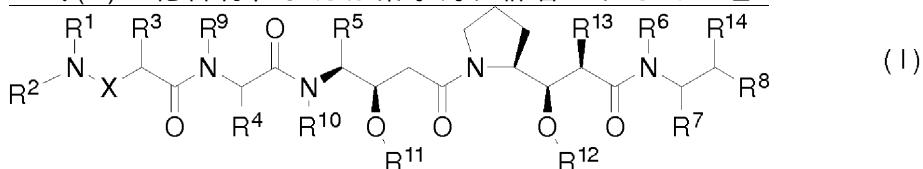
【補正の内容】

## 【 0 0 1 5 】

がんの処置を必要とする対象においてがんを処置することに使用される、少なくとも1つの式(I)の化合物または薬学的に許容されるその塩を含む、製品も、本明細書において提供される。

## [本発明1001]

式(I)の化合物、または薬学的に許容されるその塩：



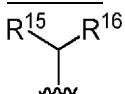
式中、

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>はそれぞれ独立して-Hまたはアルキルであり；

Xは-O-、-NR<sup>z</sup>-、-S-であるか、または存在せず；

ここでR<sup>z</sup>は-Hまたはアルキルであり；

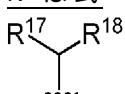
R<sup>3</sup>は式



の基であり；

ここでR<sup>15</sup>およびR<sup>16</sup>はそれぞれ独立して-H、-OH、-NH<sub>2</sub>、-SH、-N<sub>3</sub>、アルキル、アルケニル、アルキニル、-アルキル-OH、-アルキル-NH<sub>2</sub>、-アルキル-SH、または-アルキル-N<sub>3</sub>であり；

R<sup>4</sup>は式



の基であり；

ここでR<sup>17</sup>およびR<sup>18</sup>はそれぞれ独立して-H、-OH、-NH<sub>2</sub>、-SH、-N<sub>3</sub>、-CO<sub>2</sub>H、アルキル、アルケニル、アルキニル、-アルキル-OH、-アルキル-NH<sub>2</sub>、-アルキル-SH、-アルキル-N<sub>3</sub>、または-アルキル-CO<sub>2</sub>Hであり；

R<sup>5</sup>はsec-ブチルまたはイソブチルであり；

R<sup>6</sup>は-Hまたはアルキルであり；

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>はそれぞれ独立して-H、アルキル、-CO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、CONR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>、置換もしくは非置換フェニル、または置換もしくは非置換複素環であり；

ここでR<sup>a</sup>は-Hまたはアルキルであり；

R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>はそれぞれ独立してHまたはアルキルであり；

R<sup>9</sup>は-Hまたはアルキルであり；あるいは、R<sup>9</sup>はR<sup>4</sup>およびそれらが結合している原子と一緒にになって置換または非置換ヘテロシクロアルキル環を形成し；

R<sup>10</sup>は-Hまたはアルキルであり；

R<sup>11</sup>は-Hまたはアルキルであり；

R<sup>12</sup>は-Hまたはアルキルであり；

R<sup>13</sup>は-Hまたはアルキルであり；

R<sup>14</sup>は-H、-OH、またはアルキルであり、

但し、Xが存在せず、R<sup>15</sup>、R<sup>16</sup>、R<sup>17</sup>、およびR<sup>18</sup>がそれぞれメチルである場合、R<sup>8</sup>は置換もしくは非置換フェニル、または置換もしくは非置換複素環ではない。

## [本発明1002]

Xが存在しない、本発明1001の化合物。

## [本発明1003]

R<sup>15</sup>およびR<sup>16</sup>がそれぞれ独立して-Hまたはアルキルであり；

R<sup>7</sup>が-H、-CO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、-CONR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>、または置換もしくは非置換複素環であり；

R<sup>8</sup>が置換もしくは非置換フェニル、または置換もしくは非置換複素環であり；

R<sup>14</sup>が-Hである、

本発明1002の化合物。

[本発明1004]

R<sup>15</sup>およびR<sup>16</sup>がそれぞれメチルである、本発明1003の化合物。

[本発明1005]

R<sup>17</sup>が-OH、-NH<sub>2</sub>、-SH、または-N<sub>3</sub>であり；

R<sup>18</sup>は-Hまたはアルキルである、

本発明1004の化合物。

[本発明1006]

R<sup>7</sup>が-H、-CO<sub>2</sub>R<sup>a</sup>、または-CONR<sup>b</sup>R<sup>c</sup>であり；

R<sup>8</sup>がフェニルである、

本発明1005の化合物。

[本発明1007]

以下からなる群より選択される化合物、または薬学的に許容されるその塩：

(S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-ヒドロキシ-N-メチルプロパンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート；

(S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3R)-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-ヒドロキシ-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート；

(S)-2-((ジメチルアミノ)-N-((S)-3-ヒドロキシ-1-(((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)(メチル)アミノ)-1-オキソプロパン-2-イル)-3-メチルブタンアミド；

(2S,3R)-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-ヒドロキシ-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；

(2S)-2-((ジメチルアミノ)-N-((2S)-3-ヒドロキシ-1-(((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((2S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ビペリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)(メチル)アミノ)-1-オキソプロパン-2-イル)-3-メチルブタンアミド；

(2S,3R)-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-ヒドロキシ-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((2S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ビペリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド；

(S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート；

(S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-3-アミノ-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルプロパンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート；

(S)-N-((S)-3-アミノ-1-(((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-

-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)(メチル)アミノ)-1-オキソプロパン-2-イル)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド；  
 (S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルプロパンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート；  
 (S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-4-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート；  
 (S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-4-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート；  
 (S)-2-((S)-2-(アミノオキシ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N,3-ジメチルブタンアミド；  
 ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシプロパンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニン；  
 ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((2S,3R)-2-(ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシブタンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニン；  
 (S)-2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパン酸；  
 (S)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((2S,3R)-2-(ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシブタンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド；  
 (S)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシブタンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド；  
 (S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((R)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-メルカプト-N-メチルプロパンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート；  
 (S)-2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((R)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-メルカプト-N-メチルプロパンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパン酸；  
 (S)-2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-ヒドロキシ-N-メチルプロパンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパン酸；  
 (S)-2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3R)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-ヒドロキシ-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパン酸；  
 (S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシプロパンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイ

ル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート;

(S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((2S,3R)-2-(ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシブタンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート;

(S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエート;

(S)-2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパン酸;

(2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-(フェネチルアミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド;

(2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((1S,2R)-1-ヒドロキシ-1-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド;

(2S,3S)-3-アジド-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-((4-クロロフェネチル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド;

(2S,3S)-3-アジド-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-((2-クロロフェネチル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド;

(2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-(フェネチルアミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド;

(2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((1S,2R)-1-ヒドロキシ-1-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド;

(2S,3S)-3-アミノ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-((4-クロロフェネチル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド;

(2S,3S)-3-アミノ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-((2-クロロフェネチル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド;

(S)-4-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-(フェネチルアミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド;

(S)-4-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((1S,2R)-1-ヒドロキシ-1-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキ

シ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド;

(S)-4-アミノ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-((4-クロロフェネチル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド;

(S)-4-アミノ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-((2-クロロフェネチル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド;

メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルペンタ-4-インアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット;

(2S,3S)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド;

(2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド;

(2S,3S)-3-アジド-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-(tert-ブチルアミノ)-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド;

メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-バリネット;

メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-6-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルヘキサンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット;

メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,4S)-4-アジド-1-(ジメチル-L-バリル)-N-メチルピロリジン-2-カルボキサミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット;

(S)-3-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-4-(((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-3-(((S)-1-メトキシ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)(メチル)アミノ)-4-オキソブタン酸;

(2S,3R)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-3-ヒドロキシ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((1S,2R)-1-ヒドロキシ-1-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド;

メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-セリネット;

メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-イソロイシネット;

(2S,3S)-3-アミノ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチルプロピル)ピロリジン-1-イル)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)

イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド;  
 (2S,3S)-3-アミノ-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-(tert-ブチルアミノ)-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド;  
 メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-3-アジド-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)プロパンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット;  
 メチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)ブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット;  
 (2S,3S)-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-アミノ-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-3-アジド-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)ブタンアミド;  
 ((2S,3S)-3-アジド-N-((3R,4S,5S)-1-((S)-2-((1R,2R)-3-(((S)-1-(tert-ブチルアミノ)-1-オキソ-3-フェニルプロパン-2-イル)アミノ)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソプロピル)ピロリジン-1-イル)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ブタンアミド;  
 tert-ブチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)ブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット;  
 ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-N-メチル-2-((S)-3-メチル-2-(メチルアミノ)ブタンアミド)ブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット;  
 tert-ブチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((S)-2-フェニル-1-(1H-テトラゾール-5-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド);  
 (2S,3S)-3-アジド-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-(((S)-2-フェニル-1-(1H-テトラゾール-5-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド;  
 (2S,3S)-3-アジド-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-(((S)-2-フェニル-1-(チアゾール-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド;  
 tert-ブチル ((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-メチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニネット;  
 (2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((S)-2-フェニル-1-(1H-テトラゾール-5-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド; および  
 (2S,3S)-3-アミノ-2-((S)-2-(ジメチルアミノ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-(((S)-2-フェニル-1-(1H-テトラゾール-5-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド;

チアゾール-2-イル)エチル)アミノ)プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘ  
プタン-4-イル)-N-メチルブタンアミド。

[本発明1008]

以下からなる群より選択される化合物、または薬学的に許容されるその塩：

(S)-2-((S)-2-(アミノオキシ)-3-メチルブタンアミド)-N-((3R,4S,5S)-3-メトキシ-1-((S)  
)-2-((1R,2R)-1-メトキシ-2-メチル-3-オキソ-3-((2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)  
プロピル)ピロリジン-1-イル)-5-メチル-1-オキソヘプタン-4-イル)-N,3-ジメチルブタン  
アミド；  
((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシプロ  
パンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジ  
ン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニン；  
((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((2S,3R)-2-((ジメチルアミノ)-3-ヒドロキシ  
ブタンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイル)ピロリジ  
ン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパノイル)-L-フェニルアラニン；  
(S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((S)-2-((ジメチルアミノ)-3-ヒ  
ドロキシプロパンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノイ  
ル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエー  
ト； および  
(S)-メチル 2-((2R,3R)-3-((S)-1-((3R,4S,5S)-4-((S)-2-((2S,3R)-2-((ジメチルアミノ)-  
3-ヒドロキシブタンアミド)-N,3-ジメチルブタンアミド)-3-メトキシ-5-メチルヘプタノ  
イル)ピロリジン-2-イル)-3-メトキシ-2-メチルプロパンアミド)-3-フェニルプロパノエ  
ート。

[本発明1009]

有効量の本発明1001の化合物または薬学的に許容されるその塩と、薬学的に許容される  
賦形剤とを含む、薬学的組成物。

[本発明1010]

そのような処置を必要とする対象におけるがんの処置のための薬学的組成物である、本  
発明1009の薬学的組成物。

[本発明1011]

そのような処置を必要とする対象におけるがんの処置のための医薬の製造のための、本  
発明1001の化合物または薬学的に許容されるその塩の使用。

[本発明1012]

そのような処置を必要とする対象におけるがんの処置のための、本発明1001の化合物ま  
たは薬学的に許容されるその塩の使用。

[本発明1013]

そのような処置を必要とする対象におけるがんの処置のための、本発明1001の化合物ま  
たは薬学的に許容されるその塩。

[本発明1014]

がんを処置する方法であって、それを必要とする対象に有効量の本発明1001の化合物ま  
たは薬学的に許容されるその塩を投与する段階を含む、方法。