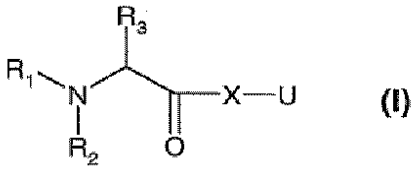
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成21年7月23日(2009.7.23)

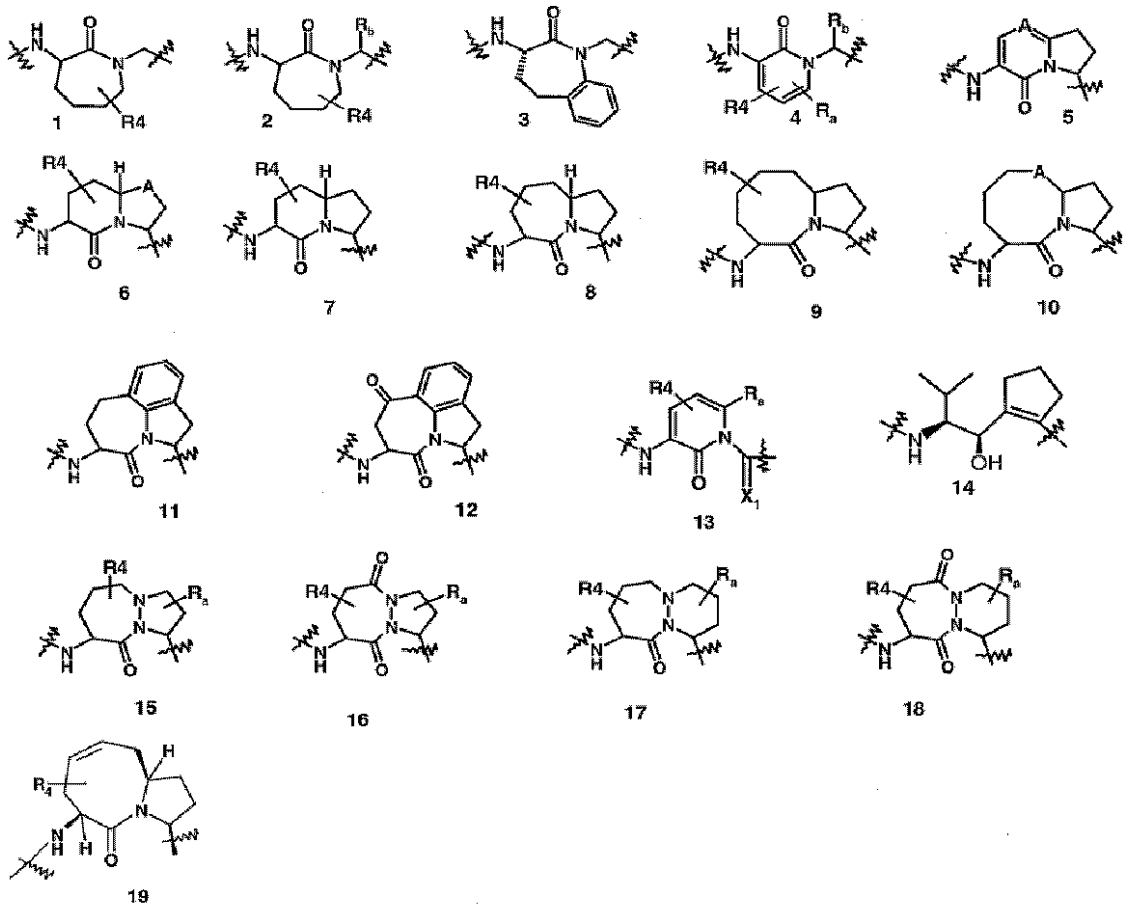
【公表番号】特表2008-545780(P2008-545780A)
【公表日】平成20年12月18日(2008.12.18)
【年通号数】公開・登録公報2008-050
【出願番号】特願2008-515811(P2008-515811)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 213/75　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 487/04　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 471/04　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 513/04　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 223/12　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 223/16　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/06　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/551　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/55　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/437　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/395　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4412　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4439　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 213/75　ＣＳＰ
Ｃ０７Ｄ 487/04　１５１
Ｃ０７Ｄ 487/04　１５３
Ｃ０７Ｄ 471/04　１０４Ａ
Ｃ０７Ｄ 513/04　３４５
Ｃ０７Ｄ 487/04　１５０
Ｃ０７Ｄ 223/12　Ｄ
Ｃ０７Ｄ 223/16　Ａ
Ｃ０７Ｄ 487/04　１５７
Ｃ０７Ｄ 401/06
Ａ６１Ｋ 31/551
Ａ６１Ｋ 31/55
Ａ６１Ｋ 31/437
Ａ６１Ｋ 31/395
Ａ６１Ｋ 31/4412
Ａ６１Ｋ 31/4439
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 43/00　１０５

【手続補正書】
【提出日】平成21年6月4日(2009.6.4)
【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、
R_1はＨまたはC_1－C_4アルキルであり；
R_2はＨ、または非置換であるかまたはハロゲン、－ＯＨ、－ＳＨ、－OCH_3、－SCH_3、－ＣＮ、－ＳＣＮおよびニトロから選択される１個またはそれ以上の置換基により置換されているC_1－C_4アルキルであり；
R_3はＨ、C_1－C_4アルキル、－CF_3、－C_2F_5、－CH_2－Ｚであるか、またはR_2およびR_3は窒素と一緒にC_3－C_6ヘテロ脂肪族環を形成し；
ＺはＨ、－ＯＨ、Ｆ、Ｃｌ、－CH_3；－CF_3、－CH_2Cl、－CH_2Fまたは－CH_2OHであり；
Ｘは：
【化２】



{ここで、
Ａは－CH_2、－ＣＨ－、Ｎ、ＯまたはＳであり；
X_1はＯ、ＳまたはＮR_aであり；

R_4、R_aおよびR_bは独立して、H；C_1－C_{16}直鎖または分岐鎖アルキル；C_1－C_{16}アルケニル；C_1－C_{16}アルキニル；またはC_1－C_{16}シクロアルキル；－（CH_2）$_{0-6}$－フェニル；（CH_2）$_{0-6}$－ｈｅｔ；－Ｏ－C_1－C_{16}直鎖または分岐鎖アルキル、－Ｓ－C_1－C_{16}直鎖または分岐鎖アルキル；－Ｎ－C_1－C_{16}直鎖または分岐鎖アルキル；－Ｏ－C_1－C_{16}アルケニル；－Ｓ－C_1－C_{16}アルケニル；－Ｎ－C_1－C_{16}アルケニル－Ｏ－C_1－C_{16}シクロアルキル；－Ｎ－C_1－C_{16}シクロアルキル；－Ｓ－C_1－C_{16}シクロアルキル；－Ｏ－（CH_2）$_{0-6}$－フェニル；－Ｎ－（CH_2）$_{0-6}$－フェニル；－Ｓ－（CH_2）$_{0-6}$－フェニル；－Ｏ－（CH_2）$_{0-6}$－ｈｅｔ；－Ｎ－（CH_2）$_{0-6}$－ｈｅｔまたは－Ｓ－（CH_2）$_{0-6}$－ｈｅｔであるか（ここで、アルキル、シクロアルキルおよびフェニルは非置換であるかまたは置換されている）；またはR_4およびR_aは環を形成し得る｝からなる群から選択される単環式または二環式構造であり；

Ｕは－R_5；－ＣＨ（R_5）（R_6）；－ＣＯ－Ｎ（R_5）（R_6）；－ＣＯ－Ｏ（R_5）；－ＣＯ－Ｓ（R_5）；－ＣＳ－Ｎ（R_5）（R_6）；－Ｎ（R_5）－ＣＯ－Ｎ（R_5）（R_6）；－C_1－C_5アルキル－Ｎ（R_5）（R_6）；－C_1－C_5－アルキル－Ｏ（R_6）または－C_1－C_5アルキル－Ｓ（Ｏ）$_n$（R_6）であり（ここで、ｎは０、１または２である）；

R_5はＨ；C_1－C_{10}アルキル；C_3－C_7シクロアルキル；－（CH_2）$_{1-6}$－C_3－C_7シクロアルキル；－C_1－C_{10}アルキル－アリール；－（CH_2）$_{0-6}$－フェニル；－（CH_2）$_{0-6}$－C_3－C_7シクロアルキル－（CH_2）$_{0-6}$－フェニル；－（CH_2）$_{0-4}$ＣＨ－（（CH_2）$_{1-4}$－フェニル）$_2$；－（CH_2）$_{0-6}$－ＣＨ（フェニル）$_2$；－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_{10}アルキル；－Ｃ（Ｏ）－（CH_2）$_{1-6}$－C_3－C_7シクロアルキル；－Ｃ（Ｏ）－（CH_2）$_{0-6}$－フェニル；－（CH_2）$_{1-6}$－ｈｅｔ；－Ｃ（Ｏ）－（CH_2）$_{1-6}$－ｈｅｔ；－（CR_7R_8）$_{0-2}$－アリール－Ｖ－アリール；ＣＨR_6Ｃ（Ｏ）Ｎ（R_{12}）（R_{13}）；Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－ＣＨ（R_{11}）（R_{14}）であるか、またはR_5はアミノ酸残基であるか（ここで、アルキル、シクロアルキル、フェニルおよびアリール置換基は非置換であるかまたは置換されている）；

またはＵが－ＣＯ－Ｎ（R_5）（R_6）；－ＣＳ－Ｎ（R_5）（R_6）；－Ｎ（R_5）－ＣＯ－Ｎ（R_5）（R_6）；またはＮ（R_5）－ＣＯ－Ｎ（R_5）（R_6）であるとき、R_5およびR_6はＮ原子と一緒に芳香族または脂肪族ヘテロ環を形成し；

R_7およびR_8は独立してＨ、ハロゲン；C_{1-7}アルキル；－ＯC_{1-7}アルキル；C_{1-7}シクロアルキル；または－ＯC_{1-7}シクロアルキルであり（ここで、アルキル、シクロアルキル置換基は置換されていても非置換であってもよい）；

ＶはR_9；R_{10}；CR_9R_{10}；－Ｃ（Ｏ）－；Ｃ（ｈａｌ）$_2$；－Ｏ－；－Ｎ（Ｈ）－；Ｎ（アルキル）；Ｎ（アリール）；Ｓ；ＳＯ；またはＳ（Ｏ）$_2$であり；

R_9およびR_{10}は独立してＨ、ハロゲン、C_{1-7}アルキル；－ＯC_{1-7}アルキル；C_{1-7}シクロアルキル；または－ＯC_{1-7}シクロアルキル（ここで、アルキル、シクロアルキル置換基は置換されていても非置換であってもよい）；

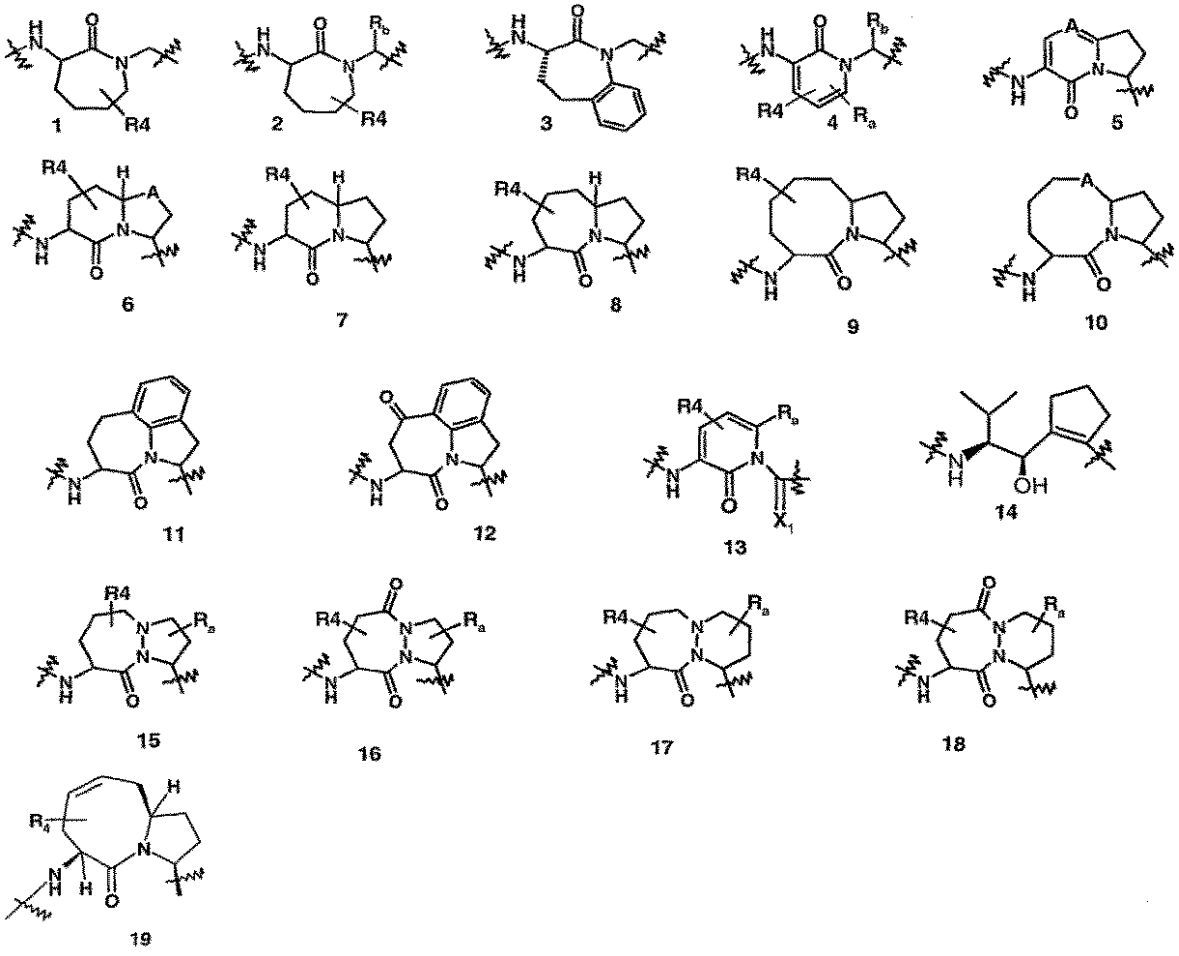
R_6はＨ；－C_1－C_{10}アルキル；－ＯＨ；－Ｏ－C_1－C_{10}アルキル；－（CH_2）$_{0-6}$－C_3－C_7シクロアルキル；－Ｏ－（CH_2）$_{0-6}$－アリール；－（CH_2）$_{0-6}$－アリール；フェニル；－（CH_2）$_{1-6}$－ｈｅｔ；－Ｏ－（CH_2）$_{1-6}$－ｈｅｔ；－Ｎ（R_{12}）（R_{13}）；－ＣＮＯR_{12}；－Ｓ－R_{12}；－Ｓ（Ｏ）－R_{12}；－Ｓ（Ｏ）$_2$－R_{12}；または－Ｓ（Ｏ）$_2$－Ｎ$R_{12}R_{13}$であり（ここで、アルキル、シクロアルキルおよびアリール置換基は非置換であるかまたは置換されている）；

R_{12}およびR_{13}は独立してＨ；C_1－C_{10}アルキル；－（CH_2）$_{0-6}$－C_3－C_7シクロアルキル；－（CH_2）$_{0-6}$－（ＣＨ）$_{0-1}$（アリール）$_{1-2}$；－Ｃ（Ｏ）－C_1－C_{10}アルキル；－Ｃ（Ｏ）－（CH_2）$_{1-6}$－C_3－C_7シクロアルキル；－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－（CH_2）$_{0-6}$－アリール；Ｃ（Ｏ）－（CH_2）$_{0-6}$－Ｏ－

フルオレニル；－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－（ＣＨ$_2$）$_{0-6}$－アリール；－Ｃ（Ｏ）－（ＣＨ$_2$）$_{0-6}$－アリール；または－Ｃ（Ｏ）－（ＣＨ$_2$）$_{1-6}$－ｈｅｔであるか（ここで、アルキル、シクロアルキルおよびアリール置換基は非置換であるかまたは置換されている）；または細胞膜を通過する分子の輸送を促進する置換基であるか、またはＲ$_{12}$およびＲ$_{13}$は窒素と一緒にｈｅｔであり；
Ｒ$_{11}$およびＲ$_{14}$はＣ$_{1-7}$アルキル；－（ＣＨ$_2$）$_{0-6}$－フェニル；またはアミドであり；
アリールは非置換であるかまたは置換されているフェニル、ナフチル、またはインダニルである〕
で示される化合物またはそれらの薬学的に許容される塩。

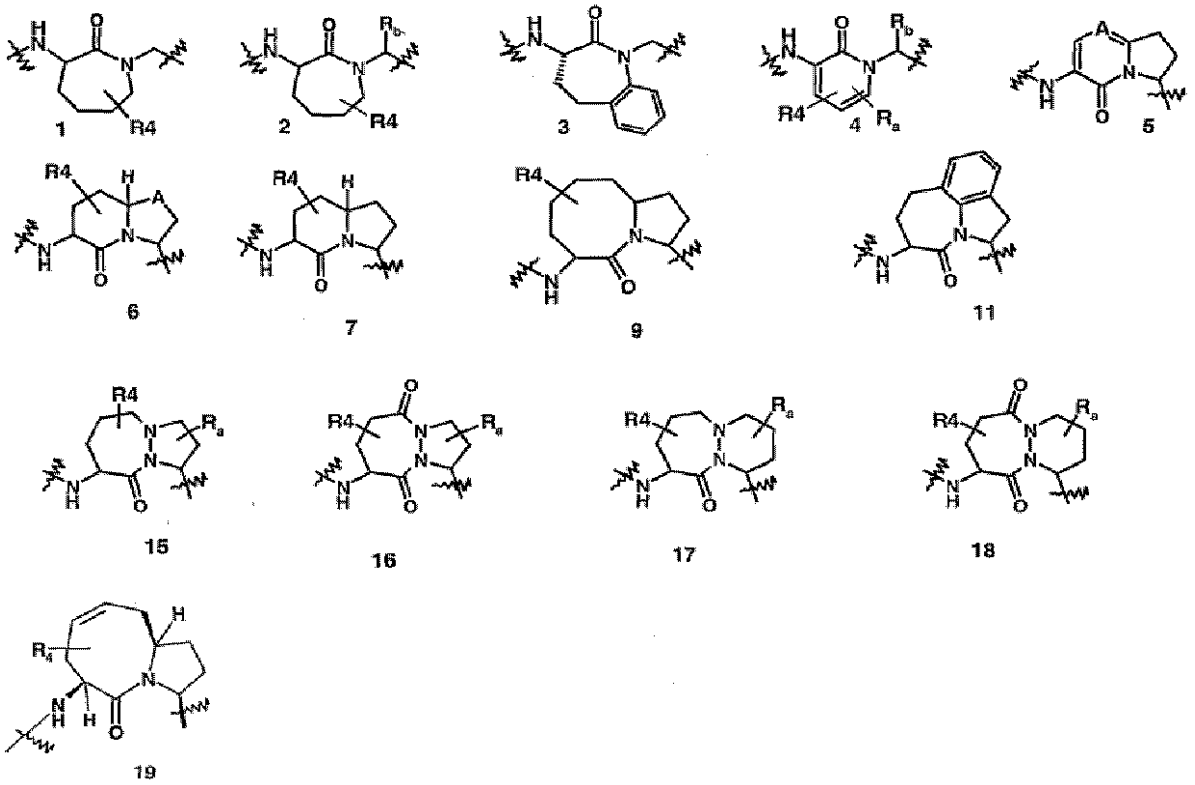
【請求項２】
Ｒ$_1$がＨまたはＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキルであり；
Ｒ$_2$がＨまたはＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキルであり；
Ｒ$_3$がＨまたはＣ$_1$－Ｃ$_4$アルキルであり；
Ｘが：

【化３】



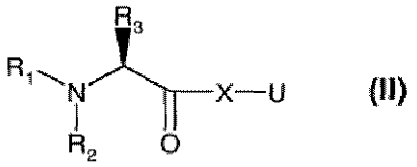
｛ここで、
Ａは－ＣＨ$_2$、－ＣＨ－、Ｎ、ＯまたはＳであり；
Ｘ$_1$はＯ、ＳまたはＮＲ$_a$であり；
Ｒ$_4$、Ｒ$_a$およびＲ$_b$は独立してＨ；Ｃ$_1$－Ｃ$_{16}$直鎖または分岐鎖アルキル；または－（ＣＨ$_2$）$_{0-6}$－フェニル（ここで、フェニルはハロで置換されていない）である｝からなる群から選択される単環式または二環式構造であり；
Ｕが－Ｒ$_5$；－ＣＨ（Ｒ$_5$）（Ｒ$_6$）；Ｃ$_1$－Ｃ$_5$アルキル－Ｎ（Ｒ$_5$）（Ｒ$_6$）；または－ＣＯ－Ｎ（Ｒ$_5$）（Ｒ$_6$）であり；

R_5がH；C_1－C_{10}アルキル；－（CH_2）$_{0-6}$－フェニル；－C（O）－C_1－C_{10}アルキル；－C（O）－（CH_2）$_{0-6}$－フェニル；－（CR_7R_8）$_{0-2}$－アリール－V－アリール；CHR_6C（O）N（R_{12}）（R_{13}）；またはC（O）－NH－CH（R_{11}）（R_{14}）であり；
R_7およびR_8が独立してH、ハロゲン；C_{1-7}アルキル；－OC_{1-7}アルキル；C_{1-7}シクロアルキル；または－OC_{1-7}シクロアルキルであり；
Vは－C（O）－；C（hal）$_2$；－O－；－N（H）－；N（アルキル）；N（アリール）；S；SO；またはS（O）$_2$であり；
R_9およびR_{10}が独立してH、ハロゲン、C_{1-7}アルキル；－OC_{1-7}アルキル；C_{1-7}シクロアルキル；または－OC_{1-7}シクロアルキルであり；
R_6がH；－C_1－C_{10}アルキル；－OH；－O－C_1－C_{10}アルキル；－（CH_2）$_{0-6}$－フェニル；－（CH_2）$_{0-6}$－アリール－；－O－（CH_2）$_{0-6}$－アリール；フェニル；－（CH_2）$_{1-6}$－het；－O－（CH_2）$_{1-6}$－het；－N（R_{12}）（R_{13}）；－CNOR_{12}；－S－R_{12}；－S（O）－R_{12}；－S（O）$_2$－R_{12}；または－S（O）$_2$－N$R_{12}R_{13}$であり；
R_{12}およびR_{13}が独立してHまたはC_1－C_{10}アルキルであり；
R_{11}およびR_{14}がC_{1-7}アルキル；－（CH_2）$_{0-6}$－フェニル；またはアミドであり；
アリールは非置換であるかまたは置換されているフェニル、ナフチル、またはインダニルである；
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物またはそれらの薬学的に許容される塩。
【請求項３】
R_1、R_2およびR_3が独立してHまたはC_1－C_4アルキルであり；
Xが：
【化４】



｛ここで、
Aは－CH_2、－CH－、N、OまたはSであり；
X_1はO、SまたはNR_aであり；
R_4、R_aおよびR_bは独立して、H；C_1－C_{16}直鎖または分岐鎖アルキル；または

－（ＣＨ$_2$）$_{0－6}$－フェニルである｝からなる群から選択される単環式または二環式構造であり；
Ｕが－Ｒ$_5$；－ＣＯ－Ｎ（Ｒ$_5$）（Ｒ$_6$）またはＣ$_1$－Ｃ$_5$アルキル－ＮＲ$_6$であり；
Ｒ$_5$がＨ；－（ＣＨ$_2$）$_{0－6}$－フェニル；アリール－Ｖ－アリール；またはＣ（Ｏ）－ＮＨ－ＣＨ（Ｒ$_{11}$）（Ｒ$_{14}$）であり（ここで、アリールまたはフェニルは置換されていても非置換であってもよい）；
Ｖが－Ｏ－であり；
Ｒ$_6$がＨ；－Ｃ$_1$－Ｃ$_{10}$アルキル；－ＯＨ；－Ｏ－Ｃ$_1$－Ｃ$_{10}$アルキル；－Ｏ－（ＣＨ$_2$）$_{0－6}$－フェニル；－（ＣＨ$_2$）$_{0－6}$－フェニル；インダニルまたはフェニルであり；
Ｒ$_{11}$およびＲ$_{14}$がＣ$_{1－7}$アルキル；－（ＣＨ$_2$）$_{0－6}$－フェニル；またはアミドであり；
アリールは非置換であるかまたは置換されているフェニル、ナフチル、またはインダニルである；
請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物またはそれらの薬学的に許容される塩。
【請求項４】
下記の立体化学：
【化５】



を有する請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物。
【請求項５】
増殖性疾患を処置するための請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物の使用。
【請求項６】
薬学的に許容される担体および治療有効量の請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物を含む医薬組成物。
【請求項７】
処置の必要な哺乳動物に治療有効量の請求項１に記載の式（Ｉ）の化合物を投与することを含む増殖性疾患の処置法。
【請求項８】
哺乳動物がヒトである請求項７に記載の方法。
【請求項９】
式（Ｉ）の化合物の製造法であって：
（ａ）ＤＣＣ／ＨＯＢｔまたはＨＢＴＵ／ＨＯＢｔのようなペプチドカップリング剤を使用して、アミンＨＸＵをｔ－Ｂｏｃ－Ｌ－アミノ酸とまたはその誘導体とカップリングし
（ｂ）ｔ－Ｂｏｃをトリフルオロ酢酸で除去する
ことを含む方法。
【請求項１０】
カップリング剤がＤＣＣ／ＨＯＢｔまたはＨＢＴＵ／ＨＯＢｔである請求項９に記載の方法。
【請求項１１】
（１Ｓ，９Ｓ）－９－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－ブチリルアミノ）－６，１０－ジオキソ－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－１－カルボン酸フェネチル－アミド；
（１Ｓ，９Ｓ）－９－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－プロピオニルアミノ）－６，１０－ジオキソ－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２］［１，２］ジアゼピン－１－カルボン酸

フェネチル－アミド；
（１Ｓ，９Ｓ）－９－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－プロピオニルアミノ）－１０－オキソ－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－１－カルボン酸フェネチル－アミド；
（１Ｓ，８Ｓ）－８－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－プロピオニルアミノ）－９－オキソ－ヘキサヒドロ－ピラゾロ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－１－カルボン酸フェネチル－アミド；
（１Ｓ，８Ｓ）－８－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－ブチリルアミノ）－５，９－ジオキソ－ヘキサヒドロ－ピラゾロ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－１－カルボン酸フェネチル－アミド；
（１Ｓ，８Ｓ）－８－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－プロピオニルアミノ）－５，９－ジオキソ－ヘキサヒドロ－ピラゾロ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－１－カルボン酸フェネチル－アミド；
（１Ｓ，８Ｓ）－８－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－ブチリルアミノ）－９－オキソ－ヘキサヒドロ－ピラゾロ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－１－カルボン酸フェネチル－アミド；
（２Ｓ，５Ｓ）－５－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－プロピオニルアミノ）－４－オキソ－１，２，４，５，６，７－ヘキサヒドロ－アゼピノ［３，２，１－ｈｉ］インドール－２－カルボン酸フェネチル－アミド；
（３Ｓ，６Ｓ，８ａＳ）－６－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－プロピオニルアミノ）－５－オキソ－オクタヒドロ－インドリジン－３－カルボン酸フェネチル－アミド；
（３Ｒ，６Ｓ，８ａＳ）－６－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－プロピオニルアミノ）－５－オキソ－ヘキサヒドロ－チアゾロ［３，２－ａ］ピリジン－３－カルボン酸フェネチル－アミド；
（６Ｓ，１０ａＳ）－６－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－プロピオニルアミノ）－５－オキソ－デカヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゾシン－３－カルボン酸フェネチル－アミド；
（Ｚ）－（３Ｓ，６Ｓ，１０ａＲ）－６－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－プロピオニルアミノ）－５－オキソ－１，２，３，５，６，７，１０，１０ａ－オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゾシン－３－カルボン酸フェネチル－アミド；
（Ｓ）－２－アミノ－Ｎ－｛１－［（（Ｓ）－１－カルバモイル－２－フェニル－エチルカルバモイル）－メチル］－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－プロピオンアミド；
（Ｓ）－２－メチルアミノ－Ｎ－［２－オキソ－１－（フェネチルカルバモイル－メチル）－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－プロピオンアミド；
（Ｓ）－２－メチルアミノ－Ｎ－［２－オキソ－１－（フェネチルカルバモイル－メチル）－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－プロピオンアミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［６－メチル－２－オキソ－１－（フェネチルカルバモイル－メチル）－５－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－［６－ブチル－２－オキソ－１－（フェネチルカルバモイル－メチル）－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［６－メチル－２－オキソ－１－（フェネチルカルバモイル－メチル）－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－［６－ベンジル－２－オキソ－１－（フェネチルカルバモイル－メチル）－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－２－メチルアミノ－Ｎ－［２－オキソ－１－（３－フェノキシ－ベンジル）－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－プロピオンアミド；
（Ｓ）－２－メチルアミノ－Ｎ－［２－オキソ－１－（３－フェノキシ－ベンジル）－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－ブチラミド；
（Ｓ）－６－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－ブチリルアミノ）－５－オキソ－１，２，３

，５－テトラヒドロ－インドリジン－３－カルボン酸フェネチル－アミド；
（Ｓ）－６－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－プロピオニルアミノ）－５－オキソ－１，２，３，５－テトラヒドロ－インドリジン－３－カルボン酸フェネチル－アミド；
（Ｓ）－６－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－プロピオニルアミノ）－５－オキソ－１，２，３，５－テトラヒドロ－インドリジン－３－カルボン酸（２－シクロヘキシル－エチル）－アミド；
（Ｓ）－２－メチルアミノ－Ｎ－［（Ｓ）－２－オキソ－１－（フェネチルカルバモイル－メチル）－アゼパン－３－イル］－プロピオンアミド；
２－［（Ｓ）－３－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－プロピオニルアミノ）－２－オキソ－アゼパン－１－イル］－Ｎ－フェネチル－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－（（Ｓ）－１－｛［２－（２－メトキシ－フェニル）－エチルカルバモイル］－メチル｝－２－オキソ－アゼパン－３－イル）－２－メチルアミノ－プロピオンアミン；
（Ｓ）－２－アミノ－Ｎ－｛（Ｓ）－１－［（（Ｓ）－１－カルバモイル－２－フェニル－エチルカルバモイル）－メチル］－２－オキソ－アゼパン－３－イル｝－プロピオンアミド；
（Ｓ）－２－アミノ－Ｎ－｛１－［（（Ｓ）－１－カルバモイル－２－フェニル－エチルカルバモイル）－メチル］－２－オキソ－２，３，４，５－テトラヒドロ－１Ｈ－ベンゾ［ｂ］アゼピン－３－イル｝－プロピオンアミド；
（Ｓ）－２－アミノ－Ｎ－｛１－［（（Ｓ）－１－カルバモイル－２－フェニル－エチルカルバモイル）－メチル］－２－オキソ－２，３，４，５－テトラヒドロ－１Ｈ－ベンゾ［ｂ］アゼピン－３－イル｝－プロピオンアミド；
（Ｓ）－２－メチルアミノ－Ｎ－［６－メチル－２－オキソ－１－（３－フェノキシ－ベンジル）－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－プロピオンアミド；
（Ｓ）－２－メチルアミノ－Ｎ－［２－オキソ－１－（３－フェノキシ－ベンジル）－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－［６－フェニル－２－オキソ－１－（３－フェノキシ－ベンジル）－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｚ）－（２Ｓ，５Ｓ）－５－エチル－１－［（Ｓ）－２－（（Ｓ）－２－メチルアミノ－プロピオニルアミノ）－ペンタノイル］－ピロリジン－２－カルボン酸フェネチル－アミド；
およびそれらの薬学的に許容される塩から選択される化合物。
【請求項１２】
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［３－（４－フルオロ－ベンゾイル）－ベンジル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－エチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［３－（４－フルオロ－ベンゾイル）－ベンゾイル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［３－（４－フルオロ－フェニルアミノ）－ベンジル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－エチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［３－（４－フルオロ－フェニルアミノ）－ベンゾイル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－エチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－（１－｛３－［（４－フルオロ－フェニル）－メチル－アミノ］－ベンジル｝－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル）－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－（１－｛３－［（４－フルオロ－フェニル）－メチル－アミノ］－ベンゾイル｝－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル）－２－メチ

ルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［３－（４－フルオロ－フェニルスルファニル）－ベンジル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［３－（４－フルオロ－ベンゼンスルホニル）－ベンジル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［３－（４－フルオロ－フェニルスルファニル）－ベンゾイル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［３－（４－フルオロ－ベンゼンスルホニル）－ベンゾイル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［３－（４－フルオロ－フェノキシ）－ベンジル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［３－（４－フルオロ－フェノキシ）－ベンゾイル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－［３－（４－フルオロ－フェノキシ）－ベンジル］－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－［３－（４－フルオロ－ベンゾイル）－ベンジル］－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛６－（４－フルオロ－フェニル）－１－［３－（４－フルオロ－フェニルアミノ）－ベンジル］－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－（６－（４－フルオロ－フェニル）－１－｛３－［（４－フルオロ－フェニル）－メチル－アミノ］－ベンジル｝－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル）－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛６－（４－フルオロ－フェニル）－１－［３－（４－フルオロ－フェニルスルファニル）－ベンジル］－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－［３－（４－フルオロ－ベンゼンスルホニル）－ベンジル］－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－［（２，２－ジフェニル－エチルカルバモイル）－メチル］－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－［（ジフェネチルカルバモイル）－メチル］－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１－［（１，２，３，４－テトラヒドロ－ナフタレン－１－イルカルバモイル）－メチル］－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－２－メチルアミノ－Ｎ－｛２－オキソ－６－フェニル－１－［（１，２，３，４－テトラヒドロ－ナフタレン－１－イルカルバモイル）－メチル］－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［（４－フルオロ－ベンジルカルバモイル）－メチル］－２－オキソ

－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－［（４－フルオロ－ベンジルカルバモイル）－メチル］－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１－［２－（１，２，３，４－テトラヒドロ－ナフタレン－１－イルアミノ）－アセチル］－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－［６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１－（１，２，３，４－テトラヒドロ－ナフタレン－１－イルアミノオキサリル）－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１－［２－（１，２，３，４－テトラヒドロ－ナフタレン－１－イルアミノ）－エチル］－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－｛２－［エチル－（１，２，３，４－テトラヒドロ－ナフタレン－１－イル）－アミノ］－エチル｝－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－｛［エチル－（１，２，３，４－テトラヒドロ－ナフタレン－１－イル）－カルバモイル］－メチル｝－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－｛２－［エチル－（１，２，３，４－テトラヒドロ－ナフタレン－１－イル）－アミノ］－アセチル｝－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－｛［エチル－（４－フルオロ－ベンジル）－カルバモイル］－メチル｝－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－｛２－［エチル－（４－フルオロ－ベンジル）－アミノ］－エチル｝－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［２－（インダン－２－イルオキシ）－エチル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－２－メチルアミノ－Ｎ－［２－オキソ－１－（２－フェネチルスルファニル－エチル）－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－プロピオンアミド；
（Ｓ）－２－メチルアミノ－Ｎ－｛２－オキソ－６－フェニル－１－［２－（２－フェニル－エタンスルホニル）－エチル］－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－プロピオンアミド；
（Ｓ）－２－メチルアミノ－Ｎ－［２－オキソ－６－フェニル－１－（５－フェニル－ペンチル）－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－プロピオンアミド；
Ｎ－［（４Ｓ，７Ｓ）－４－（インダン－２－イルオキシメチル）－６，１０－ジオキソ－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－７－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
Ｎ－（（４Ｓ，７Ｓ）－６，１０－ジオキソ－４－フェネチルスルファニルメチル－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－７－イル）－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
Ｎ－［（４Ｓ，７Ｓ）－６，１０－ジオキソ－４－（２－フェニル－エタンスルフィニルメチル）－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－７－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
Ｎ－［（４Ｓ，７Ｓ）－６，１０－ジオキソ－４－（２－フェニル－エタンスルホニルメチル）－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－７－イル］－

２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
Ｎ－［（４Ｓ，７Ｓ）－６，１０－ジオキソ－４－（３－フェノキシ－フェニル）－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－７－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
Ｎ－｛（４Ｓ，７Ｓ）－４－［３－（４－フルオロ－フェノキシ）－フェニル］－６，１０－ジオキソ－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－７－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
Ｎ－［（４Ｓ，７Ｓ）－４－（３－ベンゾイル－フェニル）－６，１０－ジオキソ－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－７－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
Ｎ－［（４Ｓ，７Ｓ）－４－（３－ベンゾイル－フェニル）－６，１０－ジオキソ－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－７－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
Ｎ－［（４Ｓ，７Ｓ）－４－（インダン－２－イルオキシメチル）－６，１０－ジオキソ－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－７－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
Ｎ－（（４Ｓ，７Ｓ）－６，１０－ジオキソ－４－フェネチルスルファニルメチル－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－７－イル）－２－メチルアミノ－ブチラミド；
Ｎ－［（４Ｓ，７Ｓ）－６，１０－ジオキソ－４－（２－フェニル－エタンスルフィニルメチル）－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－７－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
Ｎ－［（４Ｓ，７Ｓ）－６，１０－ジオキソ－４－（２－フェニル－エタンスルホニルメチル）－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－７－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
Ｎ－［（４Ｓ，７Ｓ）－６，１０－ジオキソ－４－（３－フェノキシ－フェニル）－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－７－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
Ｎ－｛（４Ｓ，７Ｓ）－４－［３－（４－フルオロ－フェノキシ）－フェニル］－６，１０－ジオキソ－オクタヒドロ－ピリダジノ［１，２－ａ］［１，２］ジアゼピン－７－イル｝－２－メチルアミノ－ブチラミド；
Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，１０ａＳ）－３－（インダン－２－イルオキシメチル）－５－オキソ－デカヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゾシン－６－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－（（３Ｓ，６Ｓ，１０ａＳ）－５－オキソ－３－フェネチルスルファニルメチル－デカヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゾシン－６－イル）－プロピオンアミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，１０ａＳ）－５－オキソ－３－（２－フェニル－エタンスルフィニルメチル）－デカヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゾシン－６－イル］－プロピオンアミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，１０ａＳ）－５－オキソ－３－（２－フェニル－エタンスルホニルメチル）－デカヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゾシン－６－イル］－プロピオンアミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，１０ａＳ）－５－オキソ－３－（３－フェノキシ－フェニル）－デカヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゾシン－６－イル］－プロピオンアミド；
Ｎ－｛（３Ｓ，６Ｓ，１０ａＳ）－３－［３－（４－フルオロ－フェノキシ）－フェニル］－５－オキソ－デカヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゾシン－６－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，１０ａＳ）－３－（３－ベンゾイル－フェニル）－５－オキソ－デ

カヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゾシン－６－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，１０ａＳ）－３－（３－ベンゾイル－フェニル）－５－オキソ－デカヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゾシン－６－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，１０ａＳ）－５－オキソ－３－（２－フェニル－エタンスルホニルメチル）－デカヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゾシン－６－イル］－ブチラミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－（（３Ｓ，６Ｓ，１０ａＳ）－５－オキソ－３－フェネチルスルファニルメチル－デカヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゾシン－６－イル）－ブチラミド
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，１０ａＳ）－５－オキソ－３－（３－フェノキシ－フェニル）－デカヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゾシン－６－イル］－ブチラミド；
Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，１０ａＳ）－３－（インダン－２－イルオキシメチル）－５－オキソ－デカヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゾシン－６－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－｛（Ｓ）－１－［（２Ｓ，５Ｓ）－２－（２－フェニル－エタンスルフィニルメチル）－５－プロピル－ピロリジン－１－カルボニル］－プロピル｝－ブチラミド；
Ｎ－｛（３Ｓ，６Ｓ，１０ａＳ）－３－［３－（４－フルオロ－フェノキシ）－フェニル］－５－オキソ－デカヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゾシン－６－イル｝－２－メチルアミノ－ブチラミド；
Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，９ａＳ）－３－（インダン－２－イルオキシメチル）－５－オキソ－オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゼピン－６－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，９ａＳ）－５－オキソ－３－（２－フェニル－エタンスルホニルメチル）－オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゼピン－６－イル］－プロピオンアミド；
Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，９ａＳ）－３－（３－ベンゾイル－フェニル）－５－オキソ－オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゼピン－６－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－｛（３Ｓ，６Ｓ，９ａＳ）－５－オキソ－３－［３－（（Ｚ）－プロペニル）－４－ビニル－シクロペンタ－３－エニルオキシメチル］－オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゼピン－６－イル｝－ブチラミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，９ａＳ）－５－オキソ－３－（２－フェニル－エタンスルホニルメチル）－オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゼピン－６－イル］－ブチラミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－（（３Ｓ，６Ｓ，９ａＳ）－５－オキソ－３－フェネチルスルファニルメチル－オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゼピン－６－イル）－プロピオンアミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，９ａＳ）－５－オキソ－３－（３－フェノキシ－フェニル）－オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゼピン－６－イル］－プロピオンアミド；
Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，９ａＳ）－３－（３－ベンゾイル－フェニル）－５－オキソ－オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゼピン－６－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－（（３Ｓ，６Ｓ，９ａＳ）－５－オキソ－３－ヘネチルスルファニルメチル－オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゼピン－６－イル）－ブチラミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，９ａＳ）－５－オキソ－３－（３－フェノキシ－フェニル）－オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゼピン－６－イル］－ブチラミド

；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，９ａＳ）－５－オキソ－３－（２－フェニル－エタンスルフィニルメチル）－オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゼピン－６－イル］－プロピオンアミド；
Ｎ－｛（３Ｓ，６Ｓ，９ａＳ）－３－［３－（４－フルオロ－フェノキシ）－フェニル］－５－オキソ－オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゼピン－６－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，９ａＳ）－５－オキソ－３－（２－フェニル－エタンスルフィニルメチル）－オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゼピン－６－イル］－ブチラミド；
Ｎ－｛（３Ｓ，６Ｓ，９ａＳ）－３－［３－（４－フルオロ－フェノキシ）－フェニル］－５－オキソ－オクタヒドロ－ピロロ［１，２－ａ］アゼピン－６－イル｝－２－メチルアミノ－ブチラミド；
Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，８ａＳ）－３－（インダン－２－イルオキシメチル）－５－オキソ－オクタヒドロ－インドリジン－６－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，８ａＳ）－５－オキソ－３－（２－フェニル－エタンスルホニルメチル）－オクタヒドロ－インドリジン－６－イル］－プロピオンアミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－（（３Ｓ，６Ｓ，８ａＳ）－５－オキソ－３－フェネチルスルファニルメチル－オクタヒドロ－インドリジン－６－イル）－プロピオンアミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，８ａＳ）－５－オキソ－３－（２－フェニル－エタンスルフィニルメチル）－オクタヒドロ－インドリジン－６－イル］－プロピオンアミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，８ａＳ）－５－オキソ－３－（３－フェノキシ－フェニル）－オクタヒドロ－インドリジン－６－イル］－プロピオンアミド；
Ｎ－｛（３Ｓ，６Ｓ，８ａＳ）－３－［３－（４－フルオロ－フェノキシ）－フェニル］－５－オキソ－オクタヒドロ－インドリジン－６－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，８ａＳ）－３－（３－ベンゾイル－フェニル）－５－オキソ－オクタヒドロ－インドリジン－６－イル］－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，８ａＳ）－３－（３－ベンゾイル－フェニル）－５－オキソ－オクタヒドロ－インドリジン－６－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，８ａＳ）－３－（インダン－２－イルオキシメチル）－５－オキソ－オクタヒドロ－インドリジン－６－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－（（３Ｓ，６Ｓ，８ａＳ）－５－オキソ－３－フェネチルスルファニルメチル－オクタヒドロ－インドリジン－６－イル）－ブチラミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，８ａＳ）－５－オキソ－３－（２－フェニル－エタンスルフィニルメチル）－オクタヒドロ－インドリジン－６－イル］－ブチラミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，８ａＳ）－５－オキソ－３－（２－フェニル－エタンスルホニルメチル）－オクタヒドロ－インドリジン－６－イル］－ブチラミド；
２－メチルアミノ－Ｎ－［（３Ｓ，６Ｓ，８ａＳ）－５－オキソ－３－（３－フェノキシ－フェニル）－オクタヒドロ－インドリジン－６－イル］－ブチラミド；
Ｎ－｛（３Ｓ，６Ｓ，８ａＳ）－３－［３－（４－フルオロ－フェノキシ）－フェニル］－５－オキソ－オクタヒドロ－インドリジン－６－イル｝－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［２－（１，３－ジヒドロ－イソインドル－２－イル）－２－オキソ－エチル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－プロピオンアミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［２－（１，３－ジヒドロ－イソインドル－２－イル）－２－オキソ－エチル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２

－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［３－（４－フルオロ－ベンゾイル）－ベンジル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［３－（４－フルオロ－ベンゾイル）－ベンゾイル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［３－（４－フルオロ－フェニルアミノ）－ベンジル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－（１－｛３－［（４－フルオロ－フェニル）－メチル－アミノ］－ベンジル｝－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル）－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［３－（４－フルオロ－ベンゼンスルホニル）－ベンジル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［３－（４－フルオロ－フェノキシ）－ベンジル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－［３－（４－フルオロ－フェノキシ）－ベンジル］－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－［３－（４－フルオロ－ベンゾイル）－ベンジル］－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－（６－（４－フルオロ－フェニル）－１－｛３－［（４－フルオロ－フェニル）－メチル－アミノ］－ベンジル｝－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル）－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－［３－（４－フルオロ－ベンゼンスルホニル）－ベンジル］－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１－［（１，２，３，４－テトラヒドロ－ナフタレン－１－イルカルバモイル）－メチル］－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－［（４－フルオロ－ベンジルカルバモイル）－メチル］－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１－［２－（１，２，３，４－テトラヒドロ－ナフタレン－１－イルアミノ）－アセチル］－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－｛［エチル－（１，２，３，４－テトラヒドロ－ナフタレン－１－イル）－カルバモイル］－メチル｝－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－［１－｛［エチル－（４－フルオロ－ベンジル）－カルバモイル］－メチル｝－６－（４－フルオロ－フェニル）－２－オキソ－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル］－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－Ｎ－｛１－［２－（インダン－２－イルオキシ）－エチル］－２－オキソ－６－フェニル－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－２－メチルアミノ－ブチラミド；
（Ｓ）－２－メチルアミノ－Ｎ－｛２－オキソ－６－フェニル－１－［２－（２－フェニル－エタンスルホニル）－エチル］－１，２－ジヒドロ－ピリジン－３－イル｝－ブチラ

ミド；
およびそれらの薬学的に許容される塩から選択される化合物。
【手続補正２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０００９
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０００９】
Ｕは－Ｒ$_5$；－ＣＨ（Ｒ$_5$）（Ｒ$_6$）；－ＣＯ－Ｎ（Ｒ$_5$）（Ｒ$_6$）；－ＣＯ－Ｏ（Ｒ$_5$）；－ＣＯ－Ｓ（Ｒ$_5$）；－ＣＳ－Ｎ（Ｒ$_5$）（Ｒ$_6$）；－Ｎ（Ｒ$_5$）－ＣＯ－Ｎ（Ｒ$_5$）（Ｒ$_6$）；－Ｃ$_1$－Ｃ$_5$アルキル－Ｎ（Ｒ$_5$）（Ｒ$_6$）；－Ｃ$_1$－Ｃ$_5$－アルキル－Ｏ（Ｒ$_6$）または－Ｃ$_1$－Ｃ$_5$アルキル－Ｓ（Ｏ）$_n$（Ｒ$_6$）であり（ここで、ｎは０、１または２である）；
Ｒ$_5$はＨ；Ｃ$_1$－Ｃ$_{10}$アルキル；Ｃ$_3$－Ｃ$_7$シクロアルキル；－（ＣＨ$_2$）$_{1-6}$－Ｃ$_3$－Ｃ$_7$シクロアルキル；－Ｃ$_1$－Ｃ$_{10}$アルキル－アリール；－（ＣＨ$_2$）$_{0-6}$－フェニル；－（ＣＨ$_2$）$_{0-6}$－Ｃ$_3$－Ｃ$_7$シクロアルキル－（ＣＨ$_2$）$_{0-6}$－フェニル；－（ＣＨ$_2$）$_{0-4}$ＣＨ－（（ＣＨ$_2$）$_{1-4}$－フェニル）$_2$；－（ＣＨ$_2$）$_{0-6}$－ＣＨ（フェニル）$_2$；－Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_1$－Ｃ$_{10}$アルキル；－Ｃ（Ｏ）－（ＣＨ$_2$）$_{1-6}$－Ｃ$_3$－Ｃ$_7$シクロアルキル；－Ｃ（Ｏ）－（ＣＨ$_2$）$_{0-6}$－フェニル；－（ＣＨ$_2$）$_{1-6}$－ｈｅｔ；－Ｃ（Ｏ）－（ＣＨ$_2$）$_{1-6}$－ｈｅｔ；－（ＣＲ$_7$Ｒ$_8$）$_{0-2}$－アリール－Ｖ－アリール；ＣＨＲ$_6$Ｃ（Ｏ）Ｎ（Ｒ$_{12}$）（Ｒ$_{13}$）；Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－ＣＨ（Ｒ$_{11}$）（Ｒ$_{14}$）であるか、またはＲ$_5$はアミノ酸残基であるか（ここで、アルキル、シクロアルキル、フェニルおよびアリール置換基は非置換であるかまたは置換されている）；
またはＵが－ＣＯ－Ｎ（Ｒ$_5$）（Ｒ$_6$）；－ＣＳ－Ｎ（Ｒ$_5$）（Ｒ$_6$）；－Ｎ（Ｒ$_5$）－ＣＯ－Ｎ（Ｒ$_5$）（Ｒ$_6$）；またはＮ（Ｒ$_5$）－ＣＯ－Ｎ（Ｒ$_5$）（Ｒ$_6$）であるとき、Ｒ$_5$およびＲ$_6$はＮ原子と一緒に芳香族または脂肪族ヘテロ環を形成し；
Ｒ$_7$およびＲ$_8$は独立してＨ、ハロゲン；Ｃ$_{1-7}$アルキル；－ＯＣ$_{1-7}$アルキル；Ｃ$_{1-7}$シクロアルキル；または－ＯＣ$_{1-7}$シクロアルキルであり（ここで、アルキル、シクロアルキル置換基は置換されていても非置換であってもよい）；
【手続補正３】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００１０
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００１０】
ＶはＲ$_9$；Ｒ$_{10}$；ＣＲ$_9$Ｒ$_{10}$；－Ｃ（Ｏ）－；Ｃ（ｈａｌ）$_2$；－Ｏ－；－Ｎ（Ｈ）－；Ｎ（アルキル）；Ｎ（アリール）；Ｓ；ＳＯ；またはＳ（Ｏ）$_2$であり；
Ｒ$_9$およびＲ$_{10}$は独立してＨ、ハロゲン、Ｃ$_{1-7}$アルキル；－ＯＣ$_{1-7}$アルキル；Ｃ$_{1-7}$シクロアルキル；または－ＯＣ$_{1-7}$シクロアルキル（ここで、アルキル、シクロアルキル置換基は置換されていても非置換であってもよい）；
Ｒ$_6$はＨ；－Ｃ$_1$－Ｃ$_{10}$アルキル；－ＯＨ；－Ｏ－Ｃ$_1$－Ｃ$_{10}$アルキル；－（ＣＨ$_2$）$_{0-6}$－Ｃ$_3$－Ｃ$_7$シクロアルキル；－Ｏ－（ＣＨ$_2$）$_{0-6}$－アリール；－（ＣＨ$_2$）$_{0-6}$－アリール；フェニル；－（ＣＨ$_2$）$_{1-6}$－ｈｅｔ；－Ｏ－（ＣＨ$_2$）$_{1-6}$－ｈｅｔ；－Ｎ（Ｒ$_{12}$）（Ｒ$_{13}$）；－ＣＮＯＲ$_{12}$；－Ｓ－Ｒ$_{12}$；－Ｓ（Ｏ）－Ｒ$_{12}$；－Ｓ（Ｏ）$_2$－Ｒ$_{12}$；または－Ｓ（Ｏ）$_2$－ＮＲ$_{12}$Ｒ$_{13}$であり（ここで、アルキル、シクロアルキルおよびアリール置換基は非置換であるかまたは置換されている）；
Ｒ$_{12}$およびＲ$_{13}$は独立してＨ；Ｃ$_1$－Ｃ$_{10}$アルキル；－（ＣＨ$_2$）$_{0-6}$－Ｃ$_3$－Ｃ$_7$シクロアルキル；－（ＣＨ$_2$）$_{0-6}$－（ＣＨ）$_{0-1}$（アリール）$_{1-2}$；－Ｃ（

Ｏ）－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{10}$アルキル；－Ｃ（Ｏ）－（ＣＨ$_{2}$）$_{1-6}$－Ｃ$_{3}$－Ｃ$_{7}$シクロアルキル；－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－（ＣＨ$_{2}$）$_{0-6}$－アリール；Ｃ（Ｏ）－（ＣＨ$_{2}$）$_{0-6}$－Ｏ－フルオレニル；－Ｃ（Ｏ）－ＮＨ－（ＣＨ$_{2}$）$_{0-6}$－アリール；－Ｃ（Ｏ）－（ＣＨ$_{2}$）$_{0-6}$－アリール；または－Ｃ（Ｏ）－（ＣＨ$_{2}$）$_{1-6}$－ｈｅｔであるか（ここで、アルキル、シクロアルキルおよびアリール置換基は非置換であるかまたは置換されている）；または細胞膜を通過する分子の輸送を促進する置換基であるか、またはＲ$_{12}$およびＲ$_{13}$は窒素と一緒に芳香族または脂肪族ヘテロ環であり；
Ｒ$_{11}$およびＲ$_{14}$はＣ$_{1-7}$アルキル；－（ＣＨ$_{2}$）$_{0-6}$－フェニル；またはアミドであり；
アリールは非置換であるかまたは置換されているフェニル、ナフチル、またはインダニルであり
そして、ここで、
アルキル置換基は二重結合、ハロゲン（ｈａｌ）、ＯＨ、ＳＨ、－Ｏ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキルとりわけ－ＯＣＨ$_{3}$、－Ｓ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキルとりわけＳＣＨ$_{3}$、－ＣＮ、－ＳＣＮ、ニトロ、－Ｎ（Ｒ$_{1}$）（Ｒ$_{2}$）および－ＣＦ$_{3}$から選択される１個またはそれ以上の置換基により置換されていてもよく；本出願中で使用されるアルキルはアルキル鎖中の炭素の１個がＮ、ＯまたはＳで置換されているヘテロアルキルを含み；
シクロアルキル置換基は二重結合、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキル、ハロゲン、ＯＨ、ＳＨ、－Ｏ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキルとりわけ－ＯＣＨ$_{3}$、－Ｓ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{6}$アルキルとりわけ－ＳＣＨ$_{3}$、－ＣＮ、－ＳＣＮ、ニトロおよび－ＣＦ$_{3}$から選択される１個またはそれ以上の置換基より置換されていてもよく；そして
置換されているフェニルまたはアリールはハロゲン、ヒドロキシ、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルキル、Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルコキシ、ニトロ、－ＣＮ、－Ｏ－Ｃ（Ｏ）－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルキル（置換または非置換）および－Ｃ（Ｏ）－Ｏ－Ｃ$_{1}$－Ｃ$_{4}$アルキル（置換または非置換）から選択される１個またはそれ以上の置換基により置換されている〕
で示される化合物およびそれらの薬学的に許容される塩に関する。