

【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29年12月21日 (2017.12.21)

【公表番号】特表2015-528821(P2015-528821A)

【公表日】平成27年10月1日 (2015.10.1)

【年通号数】公開・登録公報2015-061

【出願番号】特願2015-525858(P2015-525858)

【国際特許分類】

C 0 7 K 5/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 K 5/06

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 37/02

【誤訳訂正書】

【提出日】平成29年11月7日 (2017.11.7)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

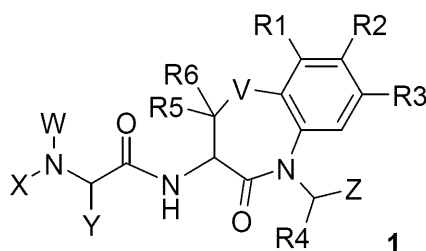
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式



[上式中：

W 及び X は、同一か又は異なっていて、H、C₁ - 6 - アルキル、ヒドロキシ - C₁ - 6 - アルキル、アリール - C₁ - 6 - アルキル、C₃ - 7 - シクロアルキル - C₁ - 6 - アルキル、C₂ - 6 - アルケニル - C₁ - 6 - アルキル、C₂ - 6 - アルキニル - C₁ - 6 - アルキル及びヘテロ環から独立して選択され、又は、

X 及び W は、それらが結合する窒素と共に、C₂ - 9 - ヘテロ環を形成してもよく、又は、結合する窒素と共に W 及び結合する炭素と共に Y は、C₃ - 9 - ヘテロ環を形成してもよく；

Y は、C₁ - 6 - アルキル、ヒドロキシ - C₁ - 6 - アルキル又は C₃ - 7 - シクロアルキル - C₁ - 6 - アルキルであり；

R 1 は、H、ハロ、C₁ - 6 - アルキル、ハロ - C₁ - 6 - アルキル、アリール - C₁ -

C_6 - アルキル、 $C_3 - 7$ - シクロアルキル - $C_1 - 6$ - アルキル、 $COOH$ 、 $C(O)N$
 R_8' 、 R_9' 、アシル、 OR_7 、 SR_7 、 NR_8R_9 、 N - アシル、 N - スルホニル、シ
 アノ及び SO_2R_{10} から選択され；

R_2 は、 H 、ハロ、 $C_1 - 6$ - アルキル、アリール - $C_1 - 6$ - アルキル、 $C_3 - 7$ - シ
 クロアルキル - $C_1 - 6$ - アルキル、アシル、 OR_7 、 SR_7 、 NR_8R_9 、 N - アシル
 、 N - スルホニル、シアノ及び SO_2R_{10} から選択され；

R_3 は、 H 、ハロ、 $C_1 - 6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - 6$ - アルキル、アリール - $C_1 - 6$ -
 $C_1 - 6$ - アルキル、 $C_3 - 7$ - シクロアルキル - $C_1 - 6$ - アルキル、アシル、 OR_7 、 SR_7 、 NR_8R_9 、 N - アシル、 N - スルホニル、シアノ及び SO_2R_{10} から選択され；

R_4 は、 H 又は $C_1 - 6$ - アルキルであり；

R_5 及び R_6 は、同一か又は異なっていて、 H 、 $C_1 - 6$ - アルキル、 $C_1 - 6$ - アルキ
 ル - $S - C_1 - 6$ - アルキル、 $C_1 - 6$ - アルキル - $O - C_1 - 6$ - アルキル、アリール
 及び $C_3 - 7$ - シクロアルキルから独立して選択され、又は、

R_5 及び R_6 は、それらが結合する炭素と共に、 $C_1 - 6$ - アルキル - SO_2 によって置
 換されていてもよい $C_4 - 7$ 炭素環又はヘテロ環を形成してもよく；

V は、 S 、 O 又は SO_2 であり

Z は、 $C_1 - 6$ - アルキル、

$C_3 - 7$ - シクロアルキル、 $C_1 - 6$ - アルキル、 $C_1 - 6$ - アルコキシ、ハロ、ハロ -
 $C_1 - 6$ - アルコキシ、 $C(O)N(C_1 - 6$ - アルキル、 $C_1 - 6$ - アルキル)、 $C(O)$
 $NHSO_2 - C_1 - 6$ - アルキル、 $C(O)N(C_1 - 6$ - アルキル、ヒドロキシ -
 $C_1 - 6$ - アルキル)、 $C(O)N(C_1 - 6$ - アルキル、 $COOH - C_1 - 6$ - アルキ
 ル)、シアノによって置換されていてもよいフェニル、 $COO - C_1 - 6$ - アルキル又は
 $COOH$ 、によって置換されていてもよいアリール；アリール - $C_1 - 6$ - アルキル、
 $C(O)N(H, C_1 - 6$ - アルキル)、シアノ又は $COOH$ によって置換されていても
 よいフェニル、 $C_1 - 6$ - アルコキシ又はシアノ、によって置換されていてもよいヘテロ
 アリール、

多環式芳香族、

ハロ、 SO_2 - フェニル、 $C_1 - 6$ - アルキル - フェニル、又はシアノによって置換され
 ていてもよいフェニル、によって置換されていてもよい多環式ヘテロ芳香族；

混合アリール及び非アリール多環及び

$SO_2 - C_1 - 6$ - アルキル、オキソ、ハロ又は $C_1 - 6$ - アルキルによって置換されて
 いてもよい混合アリール及び非アリールポリヘテロ環から選択され；

R_7 は、 $C_1 - 6$ - アルキル、アリール、ヘテロアリール又はスルホニルであり；

R_8 及び R_9 は、同一か又は異なっていて、アルキル部分がオキソによって置換されてい
 てもよい、 H 、 $C_1 - 6$ - アルキル、アリール、アリール - $C_1 - 6$ - アルキル；及びヘ
 テロアリール - $C_1 - 6$ - アルキルから独立して選択され、

R_8' は、 H 及び $C_1 - 6$ - アルキルから選択され；

R_9' は、 $HOOC - C_1 - 6$ - アルキル、ヒドロキシ - $C_1 - 6$ - アルキル及び、アリ
 ール部分が $COOH$ によって置換されるアリール - $C_1 - 6$ - アルキルから選択され、

又は、 R_8' 及び R_9' は、それらが結合する窒素と共に、ヒドロキシ - $C_1 - 6$ - アル
 キルによって置換されたヘテロシクリルを形成し；及び

R_{10} は、 $C_1 - 6$ - アルキル、アリール、ヘテロシクリル又はアリール - $C_1 - 6$ - アル
 キルである]

の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項2】

W 及び X が、同一か又は異なっていて、 H 、 $C_1 - 6$ - アルキル、ヒドロキシ - $C_1 - 6$ -
 $C_1 - 6$ - アルキル、及びヘテロ環から独立して選択され、又は、

Y が、 $C_1 - 6$ - アルキル又はヒドロキシ - $C_1 - 6$ - アルキルであり；

R_1 が、 H 、ハロ、 $C_1 - 6$ - アルキル、ハロ - $C_1 - 6$ - アルキル、 $COOH$ 、 $C(O)$
 NR_8' 、 R_9' 、 NR_8R_9 、 N - アシル又は N - スルホニルであり；

R_2 が、H、ハロ、 C_{1-6} -アルキル又はシアノであり；
 R_3 が、H、又はハロ- C_{1-6} -アルキルであり；
 R_4 が、H又は C_{1-6} -アルキルであり；
 R_5 及び R_6 が、同一か又は異なっていて、H、 C_{1-6} -アルキル、 C_{1-6} -アルキル- S - C_{1-6} -アルキル、 C_{1-6} -アルキル- O - C_{1-6} -アルキル又は C_{3-7} -シクロアルキルであり、又は、
 R_5 及び R_6 が、それらが結合する炭素と共に、 C_{1-6} -アルキル- SO_2 によって置換されていてもよい C_{4-7} 炭素環又はヘテロ環を形成してもよく、
 V が、 S 又は O ； SO_2 であり
 Z が、 C_{1-6} -アルキル、
 C_{3-7} -シクロアルキル、 C_{1-6} -アルキル、 C_{1-6} -アルコキシ、ハロ、ハロ- C_{1-6} -アルコキシ、 $C(O)N(C_{1-6}$ -アルキル、 C_{1-6} -アルキル)、 $C(O)NH SO_2$ - C_{1-6} -アルキル、 $C(O)N(C_{1-6}$ -アルキル、ヒドロキシ- C_{1-6} -アルキル)、 $C(O)N(C_{1-6}$ -アルキル、 $COOH$ - C_{1-6} -アルキル)、シアノによって置換されていてもよいフェニル、 COO - C_{1-6} -アルキル又は $COOH$ 、によって置換されていてもよいアリール；アリール- C_{1-6} -アルキル、 $C(O)N(H, C_{1-6}$ -アルキル)、シアノ又は $COOH$ によって置換されていてもよいフェニル、 C_{1-6} -アルコキシ又はシアノ、によって置換されていてもよいヘテロアリール、
ハロ、 SO_2 -フェニル、 C_{1-6} -アルキル-フェニル、又はシアノによって置換されていてもよいフェニル、によって置換されていてもよい多環式ヘテロ芳香族；及び
 SO_2 - C_{1-6} -アルキル、オキソ、ハロ又は C_{1-6} -アルキルによって置換されていてもよい混合アリール及び非アリールポリヘテロ環から選択され；
 R_8 及び R_9 が、同一か又は異なっていて、アルキル部分がオキソによって置換されていてもよい、H、 C_{1-6} -アルキル、アリール、アリール- C_{1-6} -アルキル；及びヘテロアリール- C_{1-6} -アルキルから独立して選択され、
 R_8' が、H及び C_{1-6} -アルキルから選択され；
 R_9' が、 $HOOC$ - C_{1-6} -アルキル、ヒドロキシ- C_{1-6} -アルキル、及びアリール部分が $COOH$ によって置換されるアリール- C_{1-6} -アルキル、
又は、 R_8' 及び R_9' が、それらが結合する窒素と共に、ヒドロキシ- C_{1-6} -アルキルによって置換されたヘテロシクリルを形成し；及び
 R_{10} が、 C_{1-6} -アルキル、アリール、ヘテロシクリル又はアリール- C_{1-6} -アルキルである、
請求項1に記載の式Iの化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項3】

WがHである、請求項1又は2に記載の式Iの化合物。

【請求項4】

Xが C_{1-6} -アルキルである、請求項1から3の何れか一項に記載の式Iの化合物。

【請求項5】

Yが C_{1-6} -アルキルである、請求項1から4の何れか一項に記載の式Iの化合物。

【請求項6】

R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_4 がHである、請求項1から5の何れか一項に記載の式Iの化合物。

【請求項7】

R_5 及び R_6 が個々に、H、 C_{1-6} -アルキル及び C_{4-7} -炭素環から選択される、請求項1から6の何れか一項に記載の式Iの化合物。

【請求項8】

Zが、ハロ、 C_{1-6} -アルキル及び C_{1-6} -アルコキシから選択される0から2個の置換基によって置換されていてもよいナフチルである、請求項1から6の何れか一項に記載の式Iの化合物。

【請求項 9】

W及びXが、同一か又は異なっていて、H、 C_{1-6} -アルキル、アリール- C_{1-6} -アルキル、 C_{3-7} -シクロアルキル- C_{1-6} -アルキル、 C_{2-6} -アルケニル- C_{1-6} -アルキル又は C_{2-6} -アルキニル- C_{1-6} -アルキルから独立して選択されるか、又は、

X及びWが、それらが結合する窒素と共に、 C_{2-9} -ヘテロ環を形成してもよい、又は、結合する窒素と共にW及び結合する炭素と共にYが C_{3-9} -ヘテロ環を形成してもよく；

Yが、 C_{1-6} -アルキル、又は C_{3-7} -シクロアルキル- C_{1-6} -アルキルであり；

R₁が、H、ハロ、 C_{1-6} -アルキル、アリール- C_{1-6} -アルキル、 C_{3-7} -シクロアルキル- C_{1-6} -アルキル、アシル、OR₇、SR₇、NR₈R₉、N-アシル、N-スルホニル、シアノ又はSO₂R₁₀から選択され；

R₂が、H、ハロ、 C_{1-6} -アルキル、アリール- C_{1-6} -アルキル、 C_{3-7} -シクロアルキル- C_{1-6} -アルキル、アシル、OR₇、SR₇、NR₈R₉、N-アシル、N-スルホニル、シアノ又はSO₂R₁₀から選択され；

R₃が、H、ハロ、 C_{1-6} -アルキル、アリール- C_{1-6} -アルキル、 C_{3-7} -シクロアルキル- C_{1-6} -アルキル、アシル、OR₇、SR₇、NR₈R₉、N-アシル、N-スルホニル、シアノ又はSO₂R₁₀から選択され；

R₄が、H又は C_{1-6} -アルキルであり；

R₅及びR₆が、同一か又は異なっていて、H、 C_{1-6} -アルキル、アリール又は C_{3-7} -シクロアルキルから独立して選択され、又は、

R₅及びR₆が、それらが結合する炭素と共に、R₅及びR₆は両方とも水素ではないという条件で C_{4-7} 炭素環又はヘテロ環を形成してもよく；

Vが、S又はOであり；

Zが、

アリール、

ヘテロアリール

多環式芳香族、

多環式ヘテロ芳香族、混合アリール及び非アリール多環又は

混合アリール及び非アリールポリヘテロ環から選択され；

R₇が、 C_{1-6} -アルキル、アリール、ヘテロアリール又はスルホニルであり；

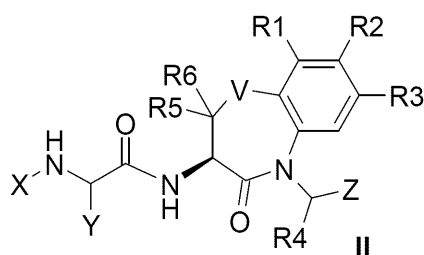
R₈及びR₉が、同一か又は異なっていて、H、 C_{1-6} -アルキル、アリール、アリール- C_{1-6} -アルキル又はヘテロアリール- C_{1-6} -アルキルから独立して選択され、

R₁₀が、 C_{1-6} -アルキル、アリール、ヘテロシクリル又はアリール- C_{1-6} -アルキルである、

請求項 1 に記載の式 I の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 10】

式



[上式中 :

X が、C₁ - 6 - アルキル、アリール - C₁ - 6 - アルキル、C₃ - 7 - シクロアルキル - C₁ - 6 - アルキル、C₂ - 6 - アルケニル - C₁ - 6 - アルキル又は C₂ - 6 - アルキニル - C₁ - 6 - アルキルから選択され；

Y が、C₁ - 6 - アルキル又は C₃ - 7 - シクロアルキル - C₁ - 6 - アルキルから選択され；

R₁ が、H、ハロ、C₁ - 6 - アルキル、アリール - C₁ - 6 - アルキル、C₃ - 7 - シクロアルキル - C₁ - 6 - アルキル、アシル、OR₇、SR₇、NR₈R₉、N - アシル、N - スルホニル、シアノ又は SO₂R₁₀ から選択され；

R₂ が、H、ハロ、C₁ - 6 - アルキル、アリール - C₁ - 6 - アルキル、C₃ - 7 - シクロアルキル - C₁ - 6 - アルキル、アシル、OR₇、SR₇、NR₈R₉、N - アシル、N - スルホニル、シアノ又は SO₂R₁₀ から選択され；

R₃ が、H、ハロ、C₁ - 6 - アルキル、アリール - C₁ - 6 - アルキル、C₃ - 7 - シクロアルキル - C₁ - 6 - アルキル、アシル、OR₇、SR₇、NR₈R₉、N - アシル、N - スルホニル、シアノ又は SO₂R₁₀ から選択され；

R₄ が、H 又は C₁ - 6 - アルキルから選択され；

R₅ 及び R₆ が、同一か又は異なっていて、H、C₁ - 6 - アルキル、アリール又は C₃ - 7 - シクロアルキル - C₁ - 6 - アルキルから独立して選択され、又は、R₅ 及び R₆ が、R₅ 及び R₆ の両方が水素ではないという条件で、それらが結合している炭素と共に C₃ - 7 - 炭素環又はヘテロ環を形成してもよく；

V が、S 又は O から選択され；

Z が、アリール、ヘテロアリール、多環式芳香族、多環式ヘテロ芳香族、混合アリール及び非アリール多環又は混合アリール及び非アリールポリヘテロ環から選択され；

R₇ が、C₁ - 6 - アルキル、アリール、ヘテロアリール又はスルホニルから選択され；

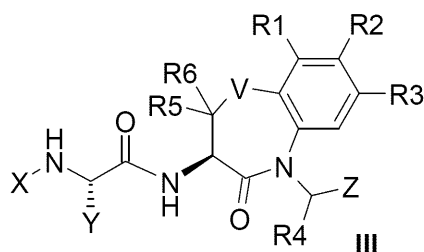
R₈ 及び R₉ が、同一か又は異なっていて、H、C₁ - 6 - アルキル、アリール、アリール - C₁ - 6 - アルキル又はヘテロアリール - C₁ - 6 - アルキルから独立して選択され；

R₁₀ が、C₁ - 6 - アルキル、アリール、ヘテロシクリル又はアリール - C₁ - 6 - アルキルから選択される]

の請求項 1 又は 2 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 11】

式



[上式中 :

X が、C₁ - 6 - アルキル、アリール - C₁ - 6 - アルキル又は C₃ - 7 - シクロアルキル - C₁ - 6 - アルキルから選択され；

Y が、C₁ - 6 - アルキル又は C₃ - 7 - シクロアルキル - C₁ - 6 - アルキルから選択され；

R₁ が、H、ハロ、C₁ - 6 - アルキル、アシル、OR₇、N - アシル、N - スルホニル、シアノ又は SO₂R₁₀ から選択され；

R₂ が、H、ハロ、C₁ - 6 - アルキル、アシル、OR₇、N - アシル、N - スルホニル

、シアノ又は $\text{SO}_2\text{R}10$ から選択され；

R3が、H、ハロ、 C_{1-6} -アルキル、アシル、OR7、N-アシル、N-スルホニル

、シアノ又は $\text{SO}_2\text{R}10$ から選択され；

R4が、H又は C_{1-6} -アルキルから選択され；

R5及びR6が、同一か又は異なっていて、H又は C_{1-6} -アルキルから独立して選択されるが、両方ともが水素ではなく、又は、R5及びR6が、それらが結合している炭素と共に C_{3-6} -炭素環又はヘテロ環を形成してもよく；

Vが、S又はOから選択され；

Zが、アリール、ヘテロアリール、多環式芳香族又は多環式ヘテロ芳香族から選択され；

R7が、 C_{1-6} -アルキル、アリール、ヘテロアリール又はスルホニルから選択され；

R10が、 C_{1-6} -アルキル、アリール、ヘテロシクリル又はアリール- C_{1-6} -アルキルから選択される]

の請求項1に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項12】

Xが、メチル、エチル、メチル-d3、エチル-d5、n-プロピル；i-プロピル、2-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル又はオキセタン-3-イルから選択され；

Yが、メチル、エチル、シクロプロピル、メチルシクロプロピル、ヒドロキシメチル、(S)-1-ヒドロキシエチル又は(R)-1-ヒドロキシエチルから選択され；

R1が、H、ハロ、 C_{1-6} -アルキル、アシル、OR7、N-アシル、N-スルホニル又はシアノから選択され；

R2が、H、ハロ、 C_{1-6} -アルキル、アシル、OR7、N-アシル、N-スルホニル又はシアノから選択され；

R3が、H、ハロ、 C_{1-6} -アルキル、アシル、OR7、N-アシル、N-スルホニル又はシアノから選択され；

R4が、H又は C_{1-6} -アルキルから選択され；

R5及びR6が、同一か又は異なっていて、H又は C_{1-6} -アルキルから独立して選択されるが、両方ともが水素ではなく、又は、R5及びR6が、それらが結合している炭素と共に C_{3-6} -炭素環又はヘテロ環を形成してもよく；

Vが、S又はOから選択され；

Zが、アリール、ヘテロアリール、多環式芳香族又は多環式ヘテロ芳香族から選択され；

R7が、 C_{1-6} -アルキル、アリール、ヘテロアリール又はスルホニルから選択される；

請求項1から11の何れか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項13】

Xが、メチル、エチル、メチル-d3、エチル-d5、又は2-ヒドロキシエチルから選択され；

Yが、メチル、エチル、シクロプロピル、ヒドロキシメチル又は(S)-1-ヒドロキシエチルから選択され；

R1が、H、ハロ、 C_{1-6} -アルキル、アシル、N-アシル又はN-スルホニル、シアノから選択され；

R2が、H、ハロ、 C_{1-6} -アルキル、アシル、N-アシル又はN-スルホニル、シアノから選択され；

R3が、H、ハロ、 C_{1-6} -アルキル、アシル、N-アシル、N-スルホニル又はシアノから選択され；

R4が、H、メチル又はエチルから選択され；

R5及びR6が、同一か又は異なっていて、H又は C_{1-6} -アルキルから独立して選択されるが、両方ともが水素ではなく、又は、R5及びR6が、それらが結合している炭素と共に C_{3-6} -炭素環又はヘテロ環を形成してもよく；

Vが、S又はOから選択され；

Z が、アリール、ヘテロアリール、多環式芳香族又は多環式ヘテロ芳香族から選択される；

請求項 1 から 1 2 の何れか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 4】

X が、メチル、エチル、メチル - d 3、エチル - d 5、又は 2 - ヒドロキシエチルから選択され；

Y が、メチル、エチル、ヒドロキシメチル又は (S) - 1 - ヒドロキシエチルから選択され；

R 1 が、H、F、Cl、Br、カルボキシアミド、N - アシル、N - スルホニル又はシアノから選択され；

R 2 が、H、F、Cl、Br、カルボキシアミド、N - アシル、N - スルホニル又はシアノから選択され；

R 3 が、H、F、Cl、Br、カルボキシアミド、N - アシル、N - スルホニル又はシアノから選択され；

R 4 が、H であり；

R 5 及び R 6 が、同一か又は異なっていて、H 又は C₁ - 6 - アルキルから独立して選択されるが、両方ともが水素ではなく、又は、R 5 及び R 6 が、それらが結合している炭素と共に C₃ - 6 - 炭素環又はヘテロ環を形成してもよく；

V が、S 又は O から選択され；

Z が、アリール、ヘテロアリール、多環式芳香族又は多環式ヘテロ芳香族から選択される；

請求項 1 から 1 3 の何れか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 5】

X が、メチル、エチル、メチル - d 3 又はエチル - d 5 から選択され；

Y が、メチル、エチル、ヒドロキシメチル又は (S) - 1 - ヒドロキシエチルから選択され；

R 1 が、H、F、Cl、Br、カルボキシアミド、N - アシル、N - スルホニル又はシアノから選択され；

R 2 が、H、F、Cl、Br、カルボキシアミド、N - アシル、N - スルホニル又はシアノから選択され；

R 3 が、H、F、Cl、Br 又はシアノから選択され；

R 4 が、H であり；

R 5 及び R 6 が、同一か又は異なっていて、H 又は C₁ - 6 - アルキルから独立して選択されるが、両方ともが水素ではなく、又は、R 5 及び R 6 が、それらが結合している炭素と共に C₃ - 6 - 炭素環又はヘテロ環を形成してもよく；

V が、O であり；

Z が、2, 5 - 二置換フェニル、2 - 置換ナフタレン - 1 - イル、2, 5 - 二置換 - ナフタレン - 1 - イル、2, 6 - 二置換 - ナフタレン - 1 - イル、2, 7 - 二置換 - ナフタレン - 1 - イル、5 - 置換 - ナフタレン - 1 - イル、1 - 置換 - 1 H - インダゾール - 3 - イル、ベンゾ [d] イソオキサゾール - 3 - イル、4 - キノリニル、5 - キノリニル、3 - 置換キノリン - 4 - イル、1, 2 - 二置換インドール - 3 - イル、1, 6 - 二置換 - 1 H - インダゾール - 3 - イル、1 - 置換 - 1, 3 - ジヒドロ - インドール - 2 - オン - 4 - イル、1, 6 - 1 H - キノリン - 2 - オン - 4 - イル、2 - 置換 - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 4 - イル、2 - (4 - メチル - インドール - 1 - イル) - ベンゾニトリル、1 - 置換インドール - 4 - イルから選択される；

請求項 1 から 1 4 の何れか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 6】

X が、メチル、エチル、メチル - d 3 又はエチル - d 5 から選択され；

Y が、メチル、エチル、ヒドロキシメチル又は (S) - 1 - ヒドロキシエチルから選択され；

R 1 が、H、F、Cl、Br、カルボキシアミド、N - アシル、N - スルホニル又はシアノから選択され；

R 2 が、H、F、Cl、Br、カルボキシアミド、N - アシル、N - スルホニル又はシアノから選択され；

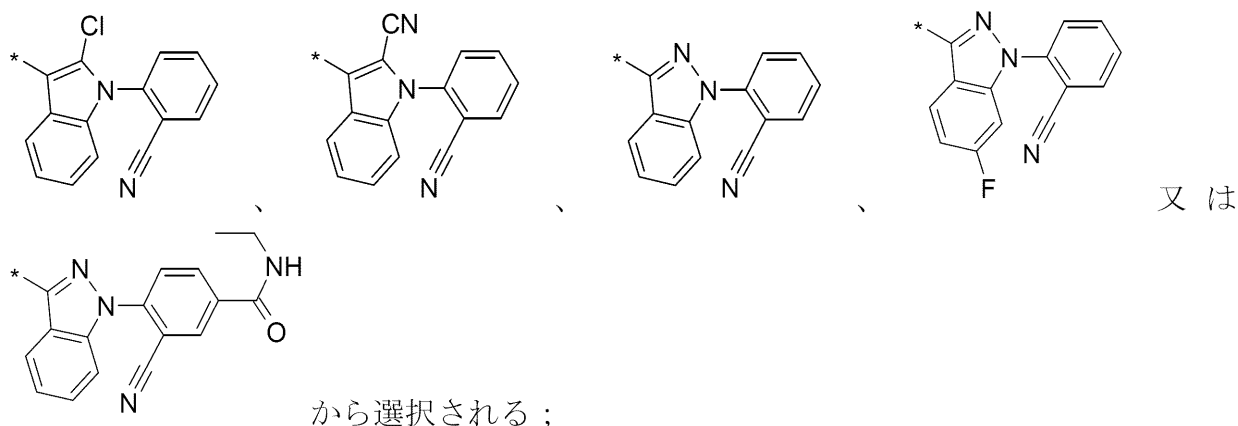
R 3 が、H、F、Cl、Br又はシアノから選択され；

R 4 が、Hであり；

R 5 及び R 6 が、メチル又はHであるが、両方ともが水素ではなく；

V が、Oであり；

Z が、5 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル、6 - ブロモ - 2 - (d 3 - メトキシ) - ナフタレン - 1 - イル、6 - ブロモ - 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イル、3 - メトキシ - キノリン - 4 - イル、キノリン - 4 - イル、2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ)ナフタレン - 1 - イル、2 - ジフルオロメトキシ - ナフタレン - 1 - イル、



請求項 1 から 1 5 の何れか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 7】

X が、メチル、エチル、メチル - d 3 又はエチル - d 5 から選択され；

Y が、メチル、エチル、ヒドロキシメチル又は (S) - 1 - ヒドロキシエチルから選択され；

R 1 が、H、F、Cl、Br、カルボキシアミド、N - アシル、N - スルホニル又はシアノから選択され；

R 2 が、H、F、Cl、Br、カルボキシアミド、N - アシル、N - スルホニル又はシアノから選択され；

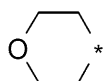
R 3 が、H、F、Cl、Br又はシアノから選択され；

R 4 が、Hであり；

R 5 及び R 6 は共に



又は

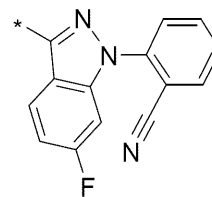
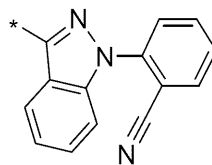
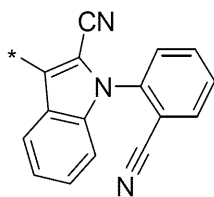
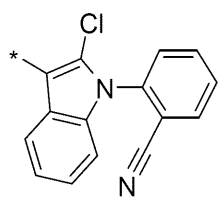


から選択される環を形成し

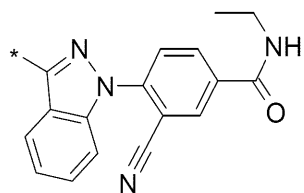
V が、Oであり；

Z が、5 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル、6 - ブロモ - 2 - (d 3 - メト

キシ) - ナフタレン - 1 - イル、6 - プロモ - 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イル、3 - メトキシ - キノリン - 4 - イル、キノリン - 4 - イル、2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) ナフタレン - 1 - イル、2 - ジフルオロメトキシ - ナフタレン - 1 - イル、



又は



から選択される；

請求項 1 から 16 の何れか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 18】

X が、メチル、エチル、メチル - d 3 又はエチル - d 5 から選択され；

Y が、メチル、エチル、ヒドロキシメチル又は (S) - 1 - ヒドロキシアセチルから選択され；

R 1 が、H、F、Cl、Br、カルボキシアミド、N - アシル、N - スルホニル又はシアノから選択され；

R 2 が、H、F、Cl、Br、カルボキシアミド、N - アシル、N - スルホニル又はシアノから選択され；

R 3 が、H、F、Cl、Br 又はシアノから選択され；

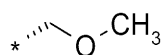
R 4 が、H であり；

R 5 が、



であり

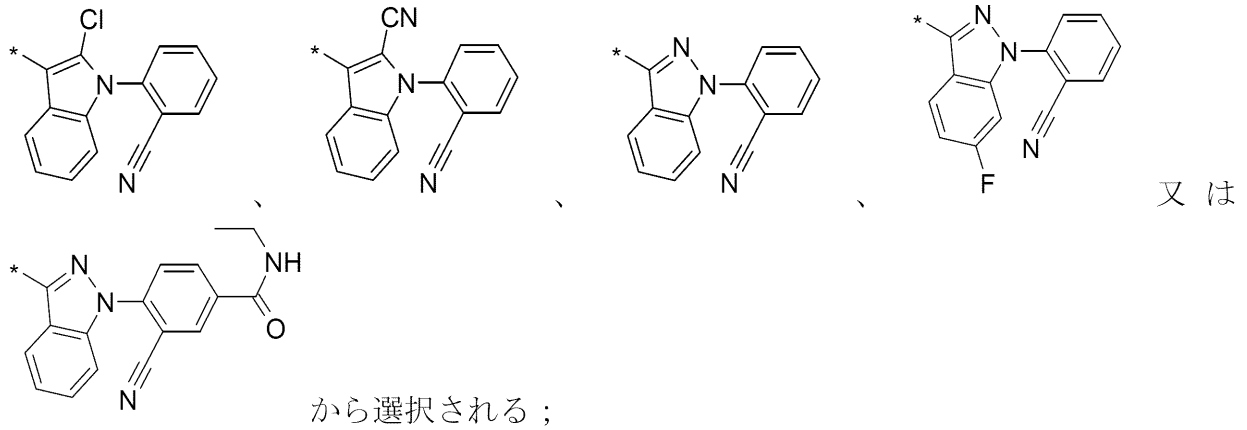
R 6 が、



であり

V が、O であり；

Z が、5 - プロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル、6 - プロモ - 2 - (d 3 - メトキシ) - ナフタレン - 1 - イル、6 - プロモ - 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イル、3 - メトキシ - キノリン - 4 - イル、キノリン - 4 - イル、2 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) ナフタレン - 1 - イル、2 - ジフルオロメトキシ - ナフタレン - 1 - イル、



請求項 1 から 17 の何れか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 19】

X が、メチル、エチル、メチル - d 3 又はエチル - d 5 から選択され；

Y が、メチル、エチル、ヒドロキシメチル又は (S) - 1 - ヒドロキシエチルから選択され；

R 1 が、H、F、Cl、Br、カルボキシアミド、N - アシル、N - スルホニル又はシアノから選択され；

R 2 が、H、F、Cl、Br、カルボキシアミド、N - アシル、N - スルホニル又はシアノから選択され；

R 3 が、H、F、Cl、Br 又はシアノから選択され；

R 4 が、H であり；

R 5 が、



であり

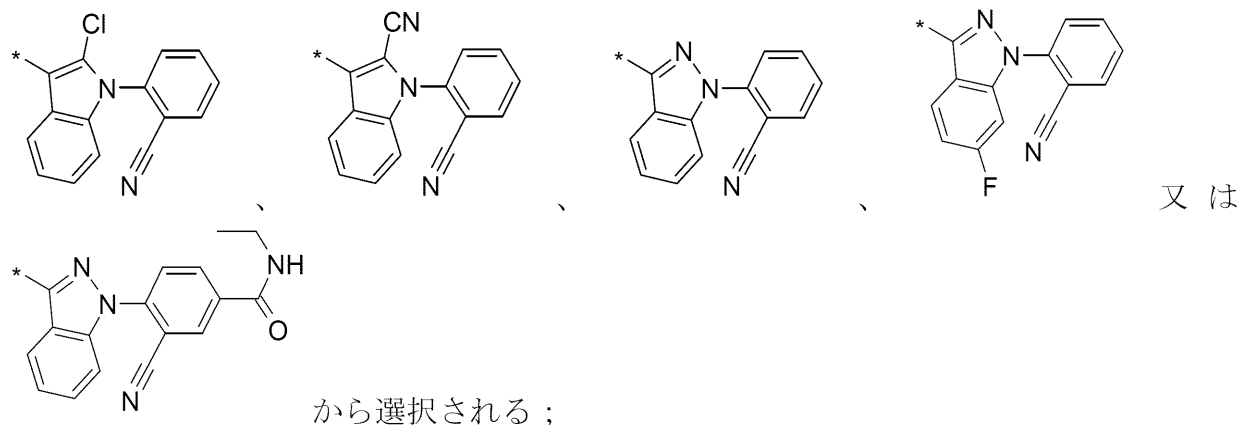
R 6 が、



であり

V が、O であり；

Z が、5 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル、6 - ブロモ - 2 - (d 3 - メトキシ) - ナフタレン - 1 - イル、6 - ブロモ - 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イル、3 - メトキシ - キノリン - 4 - イル、キノリン - 4 - イル、2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) ナフタレン - 1 - イル、2 - ジフルオロメトキシ - ナフタレン - 1 - イル、



請求項 1 から 18 の何れか一項に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 20】

(2S) - N - (5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル)メチル) - (3S) - 4 - オキソ - 4, 5 - ジヒドロ - 3H - スピロ[ベンゾ[b][1, 4]オキサゼピン - 2, 1' - シクロヘキサン] - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド塩酸塩；

6 - メトキシ - 5 - ((S) - 3 - ((S) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド) - 4 - オキソ - 2', 3', 5', 6' - テトラヒドロ - 3H - スピロ[ベンゾ[b][1, 4]オキサゼピン - 2, 4' - ピラン] - 5(4H) - イル)メチル) - 2 - ナフトエ酸トリフルオロアセテート；

6 - メトキシ - 5 - ((S) - 3 - ((S) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド) - 4 - オキソ - 2', 3', 5', 6' - テトラヒドロ - 3H - スピロ[ベンゾ[b][1, 4]オキサゼピン - 2, 4' - ピラン] - 5(4H) - イル)メチル) - N - (メチルスルホニル) - 2 - ナフトアミドトリフルオロアセテート；

(R) - N - [(S) - 5 - (6 - ブロモ - 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチル) - 2, 2 - ジメチル - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロ - ベンゾ[b][1, 4]チアゼピン - 3 - イル] - 2 - メチルアミノ - プロピオンアミド塩酸塩；

(S) - N - (5 - ベンジル - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ[b][1, 4]チアゼピン - 3 - イル) - 2 - メチルアミノプロパンアミド塩酸塩；

N - (5 - ベンジル 1, 1, 4 トリオキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ[b][1, 4]チアゼピン - 3 - イル) - 2 - (S) - (メチルアミノ)プロパンアミド塩酸塩；

N - (5 - (4 - フェニル - ブチル) - 1, 1, 4 トリオキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ[b][1, 4]チアゼピン - 3 - イル) - 2 - (S) - (メチルアミノ)プロパンアミド塩酸塩；

N - (5 - ビフェニル - 3 - イルメチル - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロ - ベンゾ[b][1, 4]チアゼピン - 3 - イル) - 2 - (S) - メチルアミノ - プロピオンアミド塩酸塩；

(2S) - N - (5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル)メチル) - (3R) - 8, 9ジフルオロ - 4 - オキソ - 2', 3', 5', 6' - テトラヒドロ - 3H - スピロ[ベンゾ[b][1, 4]オキサゼピン - 2, 4' - ピラン] - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド塩酸塩；

(2S) - N - (5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル)メチル) - (3S) - 8, 9ジフルオロ - 4 - オキソ - 2', 3', 5', 6' - テトラヒドロ - 3H - スピロ[ベンゾ[b][1, 4]オキサゼピン - 2, 4' - ピラン] - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド塩酸塩；

(2 S) - N - (5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル) メチル)
 - (3 R) - 9 - フルオロ - 4 - オキソ - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' - テトラヒドロ - 3 H
 - スピロ [ベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 2 , 4 ' - ピラン] - 3 - イル) - 2
 - (メチルアミノ) プロパンアミド塩酸塩 ;

(2 S) - N - (5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル) メチル)
 - (3 S) - 9 - フルオロ - 4 - オキソ - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' - テトラヒドロ - 3 H
 - スピロ [ベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 2 , 4 ' - ピラン] - 3 - イル) - 2
 - (メチルアミノ) プロパンアミド塩酸塩 ;

(2 S) - N - (5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル) メチル)
 - (3 R) - 9 - フルオロ - 4 - オキソ - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' - テトラヒドロ - 3 H
 - スピロ [ベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 2 , 4 ' - ピラン] - 3 - イル) - 2
 - (メチルアミノ) ブタンアミド塩酸塩 ;

(2 S) - N - (5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル) メチル)
 - (3 S) - 9 - フルオロ - 4 - オキソ - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' - テトラヒドロ - 3 H
 - スピロ [ベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 2 , 4 ' - ピラン] - 3 - イル) - 2
 - (メチルアミノ) ブタンアミド塩酸塩 ;

(2 S) - N - (5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル) メチル)
 - (3 S) - 8 - フルオロ - 4 - オキソ - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' - テトラヒドロ - 3 H
 - スピロ [ベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 2 , 4 ' - ピラン] - 3 - イル) - 2
 - (メチルアミノ) プロパンアミド塩酸塩 ;

(2 S) - N - (5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル) メチル)
 - (3 S) - 8 - フルオロ - 4 - オキソ - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' - テトラヒドロ - 3 H
 - スピロ [ベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 2 , 4 ' - ピラン] - 3 - イル) - 2
 - (メチルアミノ) ブタンアミド塩酸塩 ;

(S) - N - ((S) - 5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル) メ
 チル) - 4 - オキソ - 2 ' , 3 ' , 4 , 5 , 5 ' , 6 ' - ヘキサヒドロ - 3 H - スピロ [ベ
 ンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 2 , 4 ' - ピラン] - 3 - イル) - 2 - (2 - ヒ
 ドロキシエチルアミノ) プロパンアミド ;

(2 S) - N - (5 - ((3 - メトキシキノリン - N - オキシド - 4 - イル) メチル)
 - (3 S) - 4 - オキソ - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' - テトラヒドロ - 3 H - スピロ [ベン
 ゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 2 , 4 ' - ピラン] - 3 - イル) - 2 - (メチルアミ
 ノ) プロパンアミド ;

(2 S) - N - (5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル) メチル)
 - (3 S) - 4 - オキソ - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' - テトラヒドロ - 3 H - スピロ [ベン
 ゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 2 , 4 ' - ピラン] - 3 - イル) - 2 - (メチル - d
 3 - アミノ) プロパンアミド塩酸塩 ;

(2 S) - N - (5 - ((6 - ブロモ - 2 - (メトキシ - d 3) - ナフタレン - 1 - イ
 ル) メチル) - (3 S) - 4 - オキソ - 2 ' , 3 ' , 5 ' , 6 ' - テトラヒドロ - 3 H -
 スピロ [ベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 2 , 4 ' - ピラン] - 3 - イル) - 2 -
 (メチル - d 3 - アミノ) プロパンアミド塩酸塩 ;

(R) - N - ((S) - 5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル) メ
 チル) - 4 - オキソ - 2 ' , 3 ' , 4 , 5 , 5 ' , 6 ' - ヘキサヒドロ - 3 H - スピロ [ベ
 ンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 2 , 4 ' - ピラン] - 3 - イル) - 2 - アミノプロ
 パンアミド ;

(S) - N - ((S) - 5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル) メ
 チル) - 4 - オキソ - 2 ' , 3 ' , 4 , 5 , 5 ' , 6 ' - ヘキサヒドロ - 3 H - スピロ [ベ
 ンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 2 , 4 ' - ピラン] - 3 - イル) - 2 - アミノプロ
 パン ;

(S) - N - { (R) - 9 - [2 - (2 - メトキシ - エトキシ) - アセチルアミノ] -
 5 - ナフタレン - 1 - イルメチル - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - ベンゾ

[b] [1 , 4] チアゼピン - 3 - イル } - 2 - メチルアミノ - プロピオンアミド塩酸塩 ;

1 - アセチル - ピペリジン - 4 - カルボン酸 [(R) - 3 - ((S) - 2 - メチルアミノ - プロピオニルアミノ) - 5 - ナフタレン - 1 - イルメチル - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - ベンゾ [b] [1 , 4] チアゼピン - 9 - イル] - アミド ;

5 - オキソ - ヘキサ酸 [(R) - 3 - ((S) - 2 - メチルアミノ - プロピオニルアミノ) - 5 - ナフタレン - 1 - イルメチル - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - ベンゾ [b] [1 , 4] チアゼピン - 9 - イル] - アミド塩酸塩 ;

3 , 4 , 5 - トリメトキシ - N - [(R) - 3 - ((S) - 2 - メチルアミノ - プロピオニルアミノ) - 5 - ナフタレン - 1 - イルメチル - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - ベンゾ [b] [1 , 4] チアゼピン - 9 - イル] - ベンズアミド塩酸塩 ;

6 - オキソ - ヘプタン酸 [(R) - 3 - ((S) - 2 - メチルアミノ - プロピオニルアミノ) - 5 - ナフタレン - 1 - イルメチル - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - ベンゾ [b] [1 , 4] チアゼピン - 9 - イル] - アミド塩酸塩 ;

(S) - N - [(R) - 9 - アミノ - 5 - ナフタレン - 1 - イルメチル - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - ベンゾ [b] [1 , 4] チアゼピン - 3 - イル) - 2 - メチルアミノ - プロピオンアミド塩酸塩 ;

N - [(R) - 3 - ((S) - 2 - メチルアミノ - プロピオニルアミノ) - 5 - ナフタレン - 1 - イルメチル - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - ベンゾ [b] [1 , 4] チアゼピン - 9 - イル] - ベンズアミド塩酸塩 ;

(S) - N - [(S) - 9 - (6 - プロモ - 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチル) - 8 - オキソ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 - オキサ - 9 - アザ - ベンゾシクロヘプテン - 7 - イル] - 2 - メチルアミノ - プロピオンアミドトリフルオロアセテート ;

(S) - N - [(S) - 9 - (6 - シクロプロピル - 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチル) - 8 - オキソ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 - オキサ - 9 - アザ - ベンゾシクロヘプテン - 7 - イル] - 2 - メチルアミノ - プロピオンアミドトリフルオロアセテート ;

メチル 6 - メトキシ - 5 - (((S) - 3 - ((S) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド) - 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 5 (2 H) - イル) メチル) - 2 - ナフトエ酸トリフルオロアセテート ;

6 - メトキシ - 5 - (((S) - 3 - ((S) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド) - 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 5 (2 H) - イル) メチル) - 2 - ナフトエ酸トリフルオロアセテート ;

6 - メトキシ - 7 - [(S) - 7 - ((S) - 2 - メチルアミノ - プロピオニルアミノ) - 8 - オキソ - 7 , 8 - ジヒドロ - 6 H - 5 - オキサ - 9 - アザ - ベンゾシクロヘプテン - 9 - イルメチル] - ナフタレン - 2 - カルボン酸 (2 - ヒドロキシ - エチル) - メチル - アミド ;

4 - ({ 6 - メトキシ - 7 - [(S) - 7 - ((S) - 2 - メチルアミノ - プロピオニルアミノ) - 8 - オキソ - 7 , 8 - ジヒドロ - 6 H - 5 - オキサ - 9 - アザ - ベンゾシクロヘプテン - 9 - イルメチル] - ナフタレン - 2 - カルボニル } - アミノ) - 酪酸トリフルオロアセテート ;

6 - メトキシ - 7 - [(S) - 7 - ((S) - 2 - メチルアミノ - プロピオニルアミノ) - 8 - オキソ - 7 , 8 - ジヒドロ - 6 H - 5 - オキサ - 9 - アザ - ベンゾシクロヘプテン - 9 - イルメチル] - ナフタレン - 2 - カルボン酸ジメチルアミドトリフルオロアセテート ;

(S) - N - [(S) - 9 - (7 - プロモ - 3 - メトキシ - ナフタレン - 2 - イルメチル) - 3 - メチル - 8 - オキソ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 - オキサ - 9 - アザ - ベンゾシクロヘプテン - 7 - イル] - 2 - メチルアミノ - プロピオンアミドトリフルオロアセテート ;

(2 S , 3 R) - 2 - アミノ - N - [(S) - 9 - (7 - ブロモ - 3 - メトキシ - ナフタレン - 2 - イルメチル) - 3 - メチル - 8 - オキソ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 - オキサ - 9 - アザ - ベンゾシクロヘブテン - 7 - イル] - 3 - ヒドロキシ - ブチルアミドトリフルオロアセテート ;

(2 S , 3 S) - 2 - アミノ N - [(S) - 9 - (7 - ブロモ - 3 - メトキシ - ナフタレン - 2 - イルメチル) - 3 - メチル - 8 - オキソ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 - オキサ - 9 - アザ - ベンゾシクロヘブテン - 7 - イル] - 3 - ヒドロキシ - ブチルアミドトリフルオロアセテート ;

(S) - N - ((2 S , 3 S) - 5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル) メチル) - 2 , 8 - ジメチル - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミドトリフルオロアセテート ;

メチル 5 - (((2 S , 3 S) - 2 , 8 ジメチル - 3 - ((S) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド) - 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 5 (2 H) - イル) メチル) - 6 - メトキシ - 2 - ナフトエ酸トリフルオロアセテート ;

(2 S , 3 S) - 2 - アミノ N - [(6 S , 7 S) - 9 - (6 - ブロモ - 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチル) - 3 , 6 - ジメチル - 8 - オキソ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 - オキサ - 9 - アザ - ベンゾシクロヘブテン - 7 - イル] - 3 - ヒドロキシ - ブチルアミドトリフルオロアセテート ;

(S) - N - ((S) - 5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル) メチル) - 4 - オキソ - 7 - (トリフルオロメチル) - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミドトリフルオロアセテート ;

(S) - N - [(6 S , 7 S) - 9 - (6 - ブロモ - 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチル) - 6 - メチル - 8 - オキソ - 2 - トリフルオロメチル - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 - オキサ - 9 - アザ - ベンゾシクロヘブテン - 7 - イル] - 2 - メチルアミノ - プロピオンアミドトリフルオロアセテート ;

(S) - 2 - メチルアミノ - N - [(S) 9 - (2 - メチル - ナフタレン - 1 - イルメチル) - 8 - オキソ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 - オキサ - 9 - アザ - ベンゾシクロヘブテン - 7 - イル] - プロピオンアミド ;

(S) - N - ((S) - 5 - (2 - クロロベンジル) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド ;

(S) - N - ((S) - 5 - (3 - クロロベンジル) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド ;

(S) - N - ((S) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド ;

(S) - 5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル) メチル) - 3 - ((S) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 9 - カルボン酸トリフルオロアセテート ;

3 - { [(S) 9 - (6 - ブロモ - 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチル) - 7 - ((S) - 2 - メチルアミノ - プロピオニルアミノ) - 8 - オキソ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 - オキサ - 9 - アザ - ベンゾシクロヘブテン - 4 - カルボニル] - アミノ } - プロピオン酸トリフルオロアセテート ;

4 - ({ [(S) 9 - (6 - ブロモ - 2 - メトキシ - ナフタレン - 1 - イルメチル) - 7 - ((S) - 2 - メチルアミノ - プロピオニルアミノ) - 8 - オキソ - 6 , 7 , 8 , 9

- テトラヒドロ - 5 - オキサ - 9 - アザ - ベンゾシクロヘブテン - 4 - カルボニル] - アミノ } - メチル) - 安息香酸メチルエステル ;

(S) - 5 - ((6 - カルボキシ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル) メチル) - 3 - ((S) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 9 - カルボン酸トリフルオロアセテート ;

5 - (((S) - 9 - ((2 - ヒドロキシエチル) (メチル) カルバモイル) - 3 - ((S) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド) - 4 - オキソ - 3 , 4 - ジヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 5 (2 H) - イル) メチル) - 6 - メトキシ - 2 - ナフトエ酸トリフルオロアセテート ;

S) - 5 - ((4 - プロモナフタレン - 1 - イル) メチル) - 3 - ((S) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 9 - カルボン酸トリフルオロアセテート ;

(S) - N - ((S) - 5 - ((4 - プロモナフタレン - 1 - イル) メチル) - 9 - (4 - (2 - ヒドロキシエチル) ピペラジン - 1 - カルボニル) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド ;

(S) - N - ((S) - 5 - ((4 - プロモナフタレン - 1 - イル) メチル) - 9 - (4 - (3 - ヒドロキシプロピル) ピペラジン - 1 - カルボニル) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド ;

(S) - N - ((S) - 5 - ((2 - クロロ - 1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インドール - 3 - イル) メチル) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド ;

(S) - N - ((S) - 5 - ((1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インドール - 4 - イル) メチル) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド ;

(S) - N - ((S) - 5 - ((2 - クロロ - 1 - (フェニルスルホニル) - 1 H - インドール - 3 - イル) メチル) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド ;

(S) - N - [(S) - 9 - (1 - ベンゼンスルホニル - 2 - クロロ - 1 H - インドール - 3 - イルメチル) - 8 - オキソ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 - オキサ - 9 - アザ - ベンゾシクロヘブテン - 7 - イル] - 2 - メチルアミノ - プロピオンアミド塩酸塩 ;

(S) - N - ((S) - 5 - ((6 - フルオロ - 1 - メチル - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロキノリン - 4 - イル) メチル) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド ;

(S) - N - [(S) - 9 - (1 - ベンジル - 2 - クロロ - 1 H - インドール - 3 - イルメチル) - 8 - オキソ - 6 , 7 , 8 , 9 - テトラヒドロ - 5 - オキサ - 9 - アザ - ベンゾシクロヘブテン - 7 - イル] - 2 - メチルアミノ - プロピオンアミド ;

(S) - N - ((S) - 5 - ((1 - エチル - 2 - オキソインドリン - 4 - イル) メチル) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド ;

(S) - 2 - アミノ - N - ((S) - 5 - ((1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - イル) メチル) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 3 - イル) プロパンアミド ;

(S) - N - ((S) - 5 - ((2 - シアノ - 1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インドール - 3 - イル) メチル) - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミドトリフルオロアセテート ;

(S) - N - ((S) - 5 - ((1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1, 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (オキセタン - 3 - イルアミノ) プロパンアミド;

(S) - N - ((S) - 5 - ((1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1, 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピルアミノ) プロパンアミド;

(S) - N - ((S) - 5 - ((1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1, 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (2 - ヒドロキシアチルアミノ) プロパンアミド;

(S) - N - ((S) - 5 - ((1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 2', 3', 4, 5, 5', 6' - ヘキサヒドロ - 3 H - スピロ [ベンゾ [b] [1, 4] オキサゼピン - 2, 4' - ピラン] - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド;

(S) - N - ((S) - 5 - ((1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1, 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (エチル - d 5 - アミノ) プロパンアミド;

(S) - N - ((S) - 5 - ((1 - (2 - シアノフェニル) - 6 - フルオロ - 1 H - インダゾール - 3 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1, 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (エチルアミノ) プロパンアミド;

(S) - N - ((S) - 5 - ((6 - プロモ - 1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1, 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミドトリフルオロアセテート;

(S) - N - ((S) - 5 - ((2 - シアノ - 1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 2', 3', 4, 5, 5', 6' - ヘキサヒドロ - 3 H - スピロ [ベンゾ [b] [1, 4] オキサゼピン - 2, 4' - ピラン] - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド;

(2S) - N - ((2S, 3S) - 5 - ((1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - イル)メチル) - 2 - メチル - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1, 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (エチルアミノ) プロパンアミドトリフルオロアセテート;

(S) - N - ((R) - 5 - ((2 - シアノ - 1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - イル)メチル) - 2, 2 - ジメチル - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1, 4] チアゼピン - 3 - イル) - 2 - (エチルアミノ) プロパンアミド_i;

(S) - N - ((2S, 3S) - 5 - ((2 - シアノ - 1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - イル)メチル) - 2 - メチル - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1, 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド_i;

(S) - N - ((2S, 3S) - 5 - ((2 - シアノ - 1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - イル)メチル) - 2 - メチル - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1, 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (エチルアミノ) プロパンアミド;

(S) - N - ((S) - 8 - プロモ - 5 - ((1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 2', 3', 4, 5, 5', 6' - ヘキサヒドロ - 3 H - スピロ [ベンゾ [b] [1, 4] オキサゼピン - 2, 4' - ピラン] - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミドトリフルオロアセテート;

(S) - N - ((S) - 8 - シアノ - 5 - ((1 - (2 - シアノフェニル) - 1 H - イ

ンダゾール - 3 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 2', 3', 4, 5, 5', 6' - ヘキサヒドロ - 3H - スピロ[ベンゾ[b][1,4]オキサゼピン - 2, 4' - ピラン] - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド 2, 2, 2 - トリフルオロアセテート ;

3 - シアノ - 4 - (3 - ((2S, 3S) - 2 - メチル - 3 - ((S) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド) - 4 - オキソ - 3, 4 - ジヒドロベンゾ[b][1,4]オキサゼピン - 5(2H) - イル)メチル) - 1H - インダゾール - 1 - イル)安息香酸トリフルオロアセテート ;

3 - シアノ - N - エチル - 4 - (3 - ((2S, 3S) - 2 - メチル - 3 - ((S) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド) - 4 - オキソ - 3, 4 - ジヒドロベンゾ[b][1,4]オキサゼピン - 5(2H) - イル)メチル) - 1H - インダゾール - 1 - イル)ベンズアミドトリフルオロアセテート ;

((S) - N - ((S) - 5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ[b][1,4]オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ)ブタンアミド塩酸塩 ;

((S) - N - ((S) - 5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ[b][1,4]オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (2 - ヒドロキシエチルアミノ)ブタンアミドトリフルオロアセテート ;

((S) - N - ((S) - 5 - (ベンゾ[d]イソオキサゾール - 3 - イルメチル) - 4 - オキソ - 2', 3', 4, 5, 5', 6' - ヘキサヒドロ - 3H - スピロ[ベンゾ[b][1,4]オキサゼピン - 2, 4' - ピラン] - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド塩酸塩 ;

((S) - N - ((S) - 5 - ((2 - (ジフルオロメトキシ)ナフタレン - 1 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 2', 3', 4, 5, 5', 6' - ヘキサヒドロ - 3H - スピロ[ベンゾ[b][1,4]オキサゼピン - 2, 4' - ピラン] - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド塩酸塩 ;

((S) - N - ((R) - 5 - ((2 - (ジフルオロメトキシ)ナフタレン - 1 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 2', 3', 4, 5, 5', 6' - ヘキサヒドロ - 3H - スピロ[ベンゾ[b][1,4]オキサゼピン - 2, 4' - ピラン] - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド塩酸塩 ;

((S) - N - ((S) - 5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル)メチル) - 9 - フルオロ - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ[b][1,4]オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド塩酸塩 ;

((S) - N - ((S) - 5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 9 - (トリフルオロメチル) - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ[b][1,4]オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド塩酸塩 ;

((S) - 2 - (メチルアミノ) - N - ((S) - 5 - ((2 - メチルナフタレン - 1 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 9 - (トリフルオロメチル) - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ[b][1,4]オキサゼピン - 3 - イル)プロパンアミド塩酸塩 ;

((S) - N - ((S) - 5 - (ベンゾ[d]イソオキサゾール - 3 - イルメチル) - 4 - オキソ - 9 - (トリフルオロメチル) - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ[b][1,4]オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド塩酸塩 ;

((S) - N - ((S) - 9 - ブロモ - 5 - ((2 - メチルナフタレン - 1 - イル)メチル) - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ[b][1,4]オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド塩酸塩 ;

((S) - 5 - ((2 - メトキシナフタレン - 1 - イル)メチル) - 3 - ((S) - 2 - (メチルアミノ)プロパンアミド) - 4 - オキソ - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロベンゾ[b][1,4]オキサゼピン - 9 - カルボン酸トリフルオロアセテート、及び

(S) - N - ((S) - 5 - ((6 - ブロモ - 2 - メトキシナフタレン - 1 - イル) メチル) - 9 - メチル - 4 - オキソ - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロベンゾ [b] [1 , 4] オキサゼピン - 3 - イル) - 2 - (メチルアミノ) プロパンアミド塩酸塩、
からなる群から選択される、請求項 1 から 1 9 の何れか一項に記載の化合物。

【請求項 2 1】

請求項 1 から 2 0 の何れか一項に記載の化合物及び治療上不活性な担体を含む薬学的組成物。