

【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23年2月10日 (2011.2.10)

【公表番号】特表2006-504793(P2006-504793A)

【公表日】平成18年2月9日 (2006.2.9)

【年通号数】公開・登録公報2006-006

【出願番号】特願2004-571986(P2004-571986)

【国際特許分類】

C 07 C 233/36 (2006.01)

A 61 K 31/165 (2006.01)

A 61 K 31/341 (2006.01)

A 61 K 31/353 (2006.01)

A 61 K 31/381 (2006.01)

A 61 K 31/382 (2006.01)

A 61 K 31/4025 (2006.01)

A 61 K 31/4045 (2006.01)

A 61 K 31/4164 (2006.01)

A 61 K 31/4196 (2006.01)

A 61 K 31/42 (2006.01)

A 61 K 31/426 (2006.01)

A 61 K 31/44 (2006.01)

A 61 K 31/4409 (2006.01)

A 61 K 31/4433 (2006.01)

A 61 K 31/4706 (2006.01)

A 61 K 31/50 (2006.01)

A 61 K 31/505 (2006.01)

A 61 K 31/5375 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

C 07 D 209/14 (2006.01)

C 07 D 213/36 (2006.01)

C 07 D 215/46 (2006.01)

C 07 D 233/61 (2006.01)

C 07 D 237/14 (2006.01)

C 07 D 239/26 (2006.01)

C 07 D 249/08 (2006.01)

C 07 D 261/08 (2006.01)

C 07 D 265/30 (2006.01)

C 07 D 277/28 (2006.01)

C 07 D 307/52 (2006.01)

C 07 D 311/68 (2006.01)

C 07 D 311/76 (2006.01)

C 07 D 333/20 (2006.01)

C 07 D 335/06 (2006.01)

C 07 D 405/04 (2006.01)

【 F I 】

C 07 C 233/36

A 61 K 31/165

A 61 K 31/341

A 6 1 K 31/353
 A 6 1 K 31/381
 A 6 1 K 31/382
 A 6 1 K 31/4025
 A 6 1 K 31/4045
 A 6 1 K 31/4164
 A 6 1 K 31/4196
 A 6 1 K 31/42
 A 6 1 K 31/426
 A 6 1 K 31/44
 A 6 1 K 31/4409
 A 6 1 K 31/4433
 A 6 1 K 31/4706
 A 6 1 K 31/50
 A 6 1 K 31/505
 A 6 1 K 31/5375
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 25/28
 C 0 7 D 209/14
 C 0 7 D 213/36
 C 0 7 D 215/46
 C 0 7 D 233/61 1 0 1
 C 0 7 D 237/14
 C 0 7 D 239/26
 C 0 7 D 249/08 5 2 7
 C 0 7 D 261/08
 C 0 7 D 265/30
 C 0 7 D 277/28
 C 0 7 D 307/52
 C 0 7 D 311/68
 C 0 7 D 311/76
 C 0 7 D 333/20
 C 0 7 D 335/06 C S P
 C 0 7 D 405/04
 C 0 7 M 7:00

【誤訳訂正書】

【提出日】平成22年12月8日(2010.12.8)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 2 7 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 2 7 1】

保護ヨード - クロメン (9) は、アミン保護基の脱去としてこの技術分野専門者に周知である方法を用いて、対応するアミンへと脱保護基化される。アミン保護基の脱去の適切な方法は、保護基の性質に依存する。特定の保護基の性質を熟知している専門者には、どの試薬が脱保護に望ましいかは周知である。例えば、トリフルオロ酢酸 / ジクロルメタン (1 / 1) 混合物の中で保護ヨード - クロマンを溶解することによって望ましい保護基 B O C を脱去することが望ましい。完了すると、溶媒はそれ以上の純化なしに使用される対

応アミン（対応する塩、すなわちトリフルオロ酢酸塩として）にもたらされる減圧下で除去される。しかし、希望により、例えば再結晶のようなこの技術分野専門者に周知である方法でアミンをさらに純化することもできる。また、減塩形態を希望する場合には、穏和な塩基状態での塩処理を通じて自由塩基アミンを調整するなど、この技術分野専門者に周知である方法で獲得することができる。補足的なB O C脱保護基条件およびその他の保護基に対する脱保護基条件は、T . W . Green and P . G . M . Wuts 著、P r o t e c t i n g G r o u p s i n O r g a n i c C h e m i s t r y 第3版、J o h n W i l e y a n d S o n s (1 9 9 9 年) に見ることができる。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0273

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0273】

アシル置換のヨード - クロメン (1 0) は、化学構造式 (1 1) 化合物を供給するため、この技術分野専門者に周知である条件を使って適切に官能化された、またはガノメタリックな $R_{200}M$ と結合される。この技術分野専門者には、多種多様なアルキルとアリール基を芳香ヨウ化物に結合する方法がいくつかあることは周知である。例えば、L . S . Hegedus 著、T r a n s i t i o n M e t a l s i n t h e S y n t h e s i s o f C o m p l e x O r g a n i c M o l e c u l e s , U n i v e r s i t y S c i e n c e (1 9 9 9) を参照せよ。

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0968

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0968】

例137

以下の化合物は、基本的に上記の例および構想に示された手順と同様に生成される。

例番号 化合物

A 1 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [1 - (3 - イソプロピル - フェニル) - シクロブチルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 2 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [1 - (3 - イソプロピルフェニル) - シクロペンチルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 3 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [3 - (3 - イソプロピル - フェニル) - ビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサ - 3 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 4 . N - (1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [3 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 6 - アザ - ビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサ - 3 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 5 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [3 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 6 - メチル - 6 - アザ - ビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサ - 3 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 6 . N - [3 - [6 - アセチル - 3 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 6 - アザ - ビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサ - 3 - イルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

A 7 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [3 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 6 - メタンスルホニル - 6 - アザ - ビシクロ [3

. 1 . 0] ヘキサ - 3 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 8 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [1 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 2 , 2 , 4 , 4 - テトラメチル - 3 - オキソ - シクロブチルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 9 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [3 - ヒドロキシ - 1 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 2 , 2 , 4 , 4 - テトラメチル - シクロブチルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 10 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [5 - (3 - イソプロピル - フェニル) - オクタヒドロ - シクロペンタ [c] ピロール - 5 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 11 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [5 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 2 - メチル - オクタヒドロ - シクロペンタ [c] ピロール - 5 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 12 . N - [3 - [2 - アセチル - 5 - (3 - イソプロピル - フェニル) - オクタヒドロ - シクロペンタ [c] ピロール - 5 - イルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

A 13 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [5 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 2 - メタンスルホニル - オクタヒドロ - シクロペンタ [c] ピロール - 5 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 14 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [2 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 5 - オキソ - オクタヒドロ - ペンタレン - 2 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 15 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [5 - ヒドロキシ - 2 - (3 - イソプロピル - フェニル) - オクタヒドロ - ペンタレン - 2 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 16 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [2 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 3 a , 6 a - ジメチル - 5 - オキソ - オクタヒドロ - ペンタレン - 2 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 17 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [5 - ヒドロキシ - 2 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 3 a , 6 a - ジメチル - オクタヒドロ - ペンタレン - 2 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 18 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [2 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 5 - オキソ - シクロヘキシルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 19 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [5 - ヒドロキシ - 2 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 5 - メチル - シクロヘキシルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 20 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [2 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 5 - メタンスルホニルアミノ - シクロヘキシルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 21 . N - [3 - [5 - アセチルアミノ - 2 - (3 - イソプロピル - フェニル) - シクロヘキシルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

A 22 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [2 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 4 - オキソ - シクロヘキシルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 23 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [4 - ヒドロキシ - 2 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 4 - メチル - シクロヘキシルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 24 . N - [3 - [4 - アセチルアミノ - 2 - (3 - イソプロピル - フェニル)

- シクロヘキシルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

A 2 5 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [2 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 4 - メタンスルホニルアミノ - シクロヘキシルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

A 2 6 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [2 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 4 - オキソ - シクロペンチルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

B 1 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [4 - ヒドロキシ - 2 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 4 - メチル - シクロペンチルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

B 2 . N - [3 - [4 - アセチルアミノ - 2 - (3 - イソプロピル - フェニル) - シクロペンチルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

B 3 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [2 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 4 - メタンスルホニルアミノ - シクロペンチルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

B 4 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [4 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - ピリジン - 3 - イルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - アセトアミド ;

B 5 . N - (1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - { [4 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - ピリジン - 3 - イルメチル] - アミノ } - 2 - ヒドロキシ - プロピル) - アセトアミド ;

B 6 . N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - (5 - イソブチル - 2 - ピペラジン - 1 - イル - ベンジルアミノ) - プロピル] - アセトアミド ;

B 7 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [5 - イソブチル - 2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - ベンジルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

B 8 . N - [3 - [2 - (4 - アセチル - ピペラジン - 1 - イル) - 5 - イソブチル - ベンジルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

B 9 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [5 - イソブチル - 2 - (4 - メタンスルホニル - ピペラジン - 1 - イル) - ベンジルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

B 1 0 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [4 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - ピペリジン - 3 - イルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - アセトアミド ;

B 1 1 . N - (1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - { [4 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - ピペリジン - 3 - イルメチル] - アミノ } - 2 - ヒドロキシ - プロピル) - アセトアミド ;

B 1 2 . N - [3 - [1 - アセチル - 4 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - ピペリジン - 3 - イルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

B 1 3 . N - [3 - ([1 - アセチル - 4 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - ピペリジン - 3 - イルメチル] - アミノ) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

B 1 4 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [4 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - 1 - メタンスルホニル - ピペリジン - 3 - イルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - アセトアミド ;

B 1 5 . N - (1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - { [4 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - 1 - メタンスルホニル - ピペリジン - 3 - イルメチル] - アミノ } - 2 - ヒドロキシ - プロピル) - アセトアミド ;

B 1 6 . N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - (6 - イソプロピル - 2 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - キノリン - 4 - イルアミノ) - プロピル] - アセトアミド ;

B 1 7 . N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - (5 - イソプロピル - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 3 - イルアミノ) - プロピル] - アセトアミド ;

B 1 8 . N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - (7 - イソプロピル - 3 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 1 - イルアミノ) - プロピル] - アセトアミド ;

B 1 9 . N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - (3 - ヒドロキシ - 7 - イソプロピル - 3 - メチル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 1 - イルアミノ) - プロピル] - アセトアミド ;

B 2 0 . N - [3 - (3 - アセチルアミノ - 7 - イソプロピル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 1 - イルアミノ) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

B 2 1 . N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - (7 - イソプロピル - 3 - メタンスルホニルアミノ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 1 - イルアミノ) - プロピル] - アセトアミド ;

B 2 2 . N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - (6 - イソプロピル - 2 - オキソ - インダン - 1 - イルアミノ) - プロピル] - アセトアミド ;

B 2 3 . N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - (2 - ヒドロキシ - 6 - イソプロピル - 2 - メチル - インダン - 1 - イルアミノ) - プロピル] - アセトアミド ;

B 2 4 . N - [3 - (2 - アセチルアミノ - 6 - イソプロピル - インダン - 1 - イルアミノ) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

B 2 5 . N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - (6 - イソプロピル - 2 - メタンスルホニルアミノ - インダン - 1 - イルアミノ) - プロピル] - アセトアミド ;

B 2 6 . N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - (5 - イソブチル - 2 - ピペリジン - 4 - イル - ベンジルアミノ) - プロピル] - アセトアミド ;

C 1 . N - [3 - [2 - (1 - アセチル - ピペリジン - 4 - イル) - 5 - イソブチル - ベンジルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

C 2 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [5 - イソブチル - 2 - (1 - メタンスルホニル - ピペリジン - 4 - イル) - ベンジルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

C 3 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [5 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - 2 - ピペリジン - 4 - イル - ベンジルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - アセトアミド ;

C 4 . N - [3 - [2 - (1 - アセチル - ピペリジン - 4 - イル) - 5 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - ベンジルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

C 5 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [5 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - 2 - (1 - メタンスルホニル - ピペリジン - 4 - イル) - ベンジルア

ミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル} - アセトアミド ;

C 6 . N - [1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - (6 - イソブチル - 2 , 2 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 2⁶ - ベンゾ [c] [1 , 2] チアジン - 4 - イルアミノ) - プロピル] - アセトアミド ;

C 7 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [6 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - 1 - メチル - 2 , 2 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 2⁶ - ベンゾ [c] [1 , 2] チアジン - 4 - イルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - アセトアミド ;

C 8 . N - [3 - [6 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - 2 , 2 - ジオキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 2⁶ - ベンゾ [c] [1 , 2] チアジン - 4 - イルアミノ] - 1 - (3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

C 9 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [5 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - 2 - メタンスルホニルアミノ - ベンジルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - アセトアミド ;

C 10 . N - [3 - [2 - ベンゼンスルホニルアミノ - 5 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - ベンジルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

C 11 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [5 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - 2 - フェニルスルファモイル - ベンジルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - アセトアミド ;

C 12 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [5 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - 2 - メチルスルファモイル - ベンジルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - アセトアミド ;

C 13 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [5 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - 2 - (2 - オキソ - ピペリジン - 4 - イル) - ベンジルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - アセトアミド ;

C 14 . N - { 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [5 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - 2 - (1 - メチル - 2 - オキソ - ピペリジン - 4 - イル) - ベンジルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - アセトアミド ;

C 15 . N - [3 - [6 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - クロマン - 4 - イルアミノ] - 1 - (3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

C 16 . N - [3 - [7 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 1 - イルアミノ] - 1 - (3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

C 17 . N - [3 - [7 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 1 - イルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - 1 - (5 - ヒドロキシ - ピリジン - 2 - イルメチル) - プロピル] - アセトアミド ;

C 18 . N - [3 - [6 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - クロマン - 4 - イルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - 1 - (5 - ヒドロキシ - ピリジン - 2 - イルメチル) - プロピル] - アセトアミド ;

C 19 . N - [3 - [4 - (3 - t e r t - ブチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラン - 4 - イルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - ブチル] - アセトアミド ;

C 20 . N - [3 - [4 - (3 - t e r t - ブチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラン - 4 - イルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 , 4 - ジヒドロキシ - ブチル] - アセトアミド ;

C 21 . N - [3 - (5 - t e r t - ブチル - 2 - イミダゾール - 1 - イル - ベンジルアミノ) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - ブチル] - ア

セトアミド；

C 2 2 . N - [3 - (5 - t e r t - ブチル - 2 - イミダゾール - 1 - イル - ベンジルアミノ) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 , 4 - ジヒドロキシ - ブチル] - アセトアミド；

C 2 3 . N - { (1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [4 - (3 - イソプロピル - フェニル) - テトラヒドロ - チオピラン - 4 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド；

C 2 4 . N - { (1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [4 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 1 , 1 - ジオキソ - テトラヒドロ - チオピラン - 4 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド；

C 2 5 . N - { (1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [4 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 1 - オキソ - テトラヒドロ - チオピラン - 4 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド；

C 2 6 . N - (1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [4 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 1 - メタンスルホニル - ピペリジン - 4 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド；

D 1 . N - [(1 S , 2 R) - 3 - [1 - アセチル - 4 - (3 - イソプロピル - フェニル) - ピペリジン - 4 - イルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド；

D 2 . N - { (1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [4 - (3 - イソプロピル - フェニル) - ピペリジン - 4 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド；

D 3 . N - ((1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [4 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 1 - トリフルオロアセチル - ピペリジン - 4 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド；

D 4 . N - { (1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [4 - (3 - イソプロボキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラン - 4 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド；

D 5 . N - { (1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [4 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 1 , 1 - ジメチル - ピペリジン - 4 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド；

D 6 . N - { (1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [1 - ホルミル - 4 - (3 - イソプロピル - フェニル) - ピペリジン - 4 - イルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - アセトアミド；

D 7 . N - { (1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [1 - エチル - 4 - (3 - イソプロピル - フェニル) - ピペリジン - 4 - イルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - アセトアミド；

D 8 . N - [3 - [4 - (3 - t e r t - ブチル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラン - 4 - イルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド；

D 9 . N - { (1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - 4 - ヒドロキシ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [1 - (3 - イソプロピル - フェニル) - シクロヘキシルアミノ] - プロピル } - アセトアミド；

D 1 0 . N - { (1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [1 - (2 - イソブチル - チアゾール - 5 - イル) - 1 - メチル - エチルアミノ] - プロピル } - アセトアミド；

D 1 1 . N - ((1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [3 - (3 - イソプロボキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラン - 3 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド；

D 1 2 . N - { (1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒ

ドロキシ - 3 - [3 - (3 - イソプロピル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラン - 3 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

D 1 3 . N - ((1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [4 - (3 - イソプロポキシ - フェニル) - テトラヒドロ - ピラン - 4 - イルアミノ] - プロピル } - 2 - フルオロ - アセトアミド ;

D 1 4 . N - { ((1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [6 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - クロマン - 4 - イルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - 2 - フルオロ - アセトアミド ;

D 1 5 . N - { ((1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - { 1 - [2 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - チアゾール - 5 - イル] - 1 - メチル - エチルアミノ } - 2 - ヒドロキシ - プロピル) - アセトアミド ;

D 1 6 . N - { ((1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - { 1 - [3 - (2 , 2 - ジメチル - プロピル) - フェニル] - 1 - メチル - エチルアミノ } - 2 - ヒドロキシ - プロピル) - 2 - フルオロ - アセトアミド ;

D 1 7 . N - ((1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [4 - (3 - イソプロピル - フェニル) - テトラヒドロ - ピラン - 4 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

D 1 8 . N - { ((1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - 3 - [4 - (3 - イソプロピル - フェニル) - 1 - メチル - ピペリジン - 4 - イルアミノ] - プロピル } - アセトアミド ;

D 1 9 . N - { ((1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [1 - エタンスルホニル - 4 - (3 - イソプロピル - フェニル) - ピペリジン - 4 - イルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - アセトアミド ;

D 2 0 . N - ((1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [1 - プロパンスルホニル - 4 - (3 - イソプロピル - フェニル) - ピペリジン - 4 - イルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - アセトアミド ;

D 2 1 . N - ((1 S , 2 R) - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 3 - [2 - プロパンスルホニル - 4 - (3 - イソプロピル - フェニル) - ピペリジン - 4 - イルアミノ] - 2 - ヒドロキシ - プロピル } - アセトアミド ;

D 2 2 . N - [((1 S , 2 R) - 3 - [4 - (3 - t e r t - ブチル - フェニル) - 1 - エタンスルホニル - ピペリジン - 4 - イルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

D 2 3 . N - [((1 S , 2 R) - 3 - [4 - (3 - t e r t - ブチル - フェニル) - 1 - メタンスルホニル - ピペリジン - 4 - イルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

D 2 4 . 4 - [((2 R , 3 S) - 3 - アセチルアミノ - 4 - (3 , 5 - ジフルオロ - フェニル) - 2 - ヒドロキシ - ブチルアミノ] - 4 - (3 - t e r t - ブチル - フェニル) - ピペリジン - 1 - カルボン酸アミド ;

D 2 5 . 4 - [((2 R , 3 S) - 3 - アセチルアミノ - 4 - (3 , 5 - ジフルオロ - フェニル) - 2 - ヒドロキシ - ブチルアミノ] - 4 - (3 - t e r t - ブチル - フェニル) - ピペリジン - 1 - カルボン酸メチルアミド ;

D 2 6 . 4 - [((2 R , 3 S) - 3 - アセチルアミノ - 4 - (3 , 5 - ジフルオロ - フェニル) - 2 - ヒドロキシ - ブチルアミノ] - 4 - (3 - t e r t - ブチル - フェニル) - ピペリジン - 1 - カルボン酸メチルエステル ;

E 1 . N - [((1 S , 2 R) - 3 - [(4 S) - 4 - (3 - t e r t - ブチル - フェニル) - 1 - メタンスルホニル - アゼパン - 4 - イルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

E 2 . N - [((1 S , 2 R) - 3 - [(4 R) - 4 - (3 - t e r t - ブチル - フェニル) - 1 - メタンスルホニル - アゼパン - 4 - イルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ;

E 3 . N - [(1 S , 2 R) - 3 - [(4 R) - 4 - (3 - t e r t - ブチル - フ
エニル) - アゼパン - 4 - イルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 -
ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド ; 及び、

E 4 . N - [(1 S , 2 R) - 3 - [(4 S) - 4 - (3 - t e r t - ブチル - フ
エニル) - アゼパン - 4 - イルアミノ] - 1 - (3 , 5 - ジフルオロ - ベンジル) - 2 -
ヒドロキシ - プロピル] - アセトアミド。