

【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19年10月4日(2007.10.4)

【公表番号】特表2007-502304(P2007-502304A)

【公表日】平成19年2月8日(2007.2.8)

【年通号数】公開・登録公報2007-005

【出願番号】特願2006-523419(P2006-523419)

【国際特許分類】

C 0 7 F	5/02	(2006.01)
A 6 1 K	31/69	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	31/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	37/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	21/04	(2006.01)
A 6 1 P	3/12	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)

【F I】

C 0 7 F	5/02	C S P C
A 6 1 K	31/69	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	31/00	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	37/00	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	21/04	

A 6 1 P 3/12

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成19年8月11日(2007.8.11)

【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

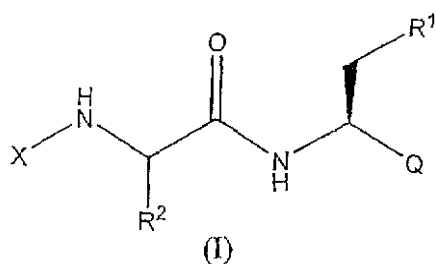
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

化学式(I)の化合物、

【化1】



または薬学的に許容可能なその塩、その立体異性体、またはその互変異性体であって、

R^1 は $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、または $C_3 - C_7$ シクロアルキルであり、

R^2 は H、 $-(CH_2)_a CH_2 NHC(=NR^4)NH-Y$ 、 $-(CH_2)_b CH_2 CONR^5 R^6$ 、 $-(CH_2)_c CH_2 N(R^4)CONH_2$ 、 $-(CH_2)_d CH(R^7)NR^9 R^{10}$ 、または $-(CH_2)_e CH(R^7)ZR^8$ であり、

a、b、および c はそれぞれ個別に 0、1、2、3、4、5、または 6 から選択され、

d および e はそれぞれ個別に 0、1、2、3、または 4 から選択され、

R^4 は H または $C_1 - C_{10}$ アルキルであり、

R^5 および R^6 はそれぞれ個別に H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、カルボシクリル、ヘテロカルボシクリル、またはアミノ保護基であり、

或いは、 R^5 および R^6 は N 原子と共に結合してヘテロカルボシクリル基を形成し、

R^7 は H または $C_1 - C_{10}$ アルキルであり、

R^8 は H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、アルキル-S(=O)₂-、アリール-S(=O)₂-、 $H_2NS(=O)_2-$ 、 $-SO_3H$ 、または保護基であり、

R^9 は H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、カルボシクリル、またはヘテロカルボシクリルであり、

R^{10} は H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、カルボシクリル、ヘテロカルボシクリル、 $C_1 - C_{10}$ アルキル-C(=O)-、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル-C(=O)-、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル-C(=O)-、カルボシクリル-C(=O)-、ヘテロカルボシクリル-C(=O)-、カルボシクリルアルキル-C(=O)-、ヘテロカルボシクリルアルキル-C(=O)-、 $C_1 - C_{10}$ アルキル-S(=O)₂-、カルボシクリル-S(=O)₂-、ヘテロカルボシクリル-S(=O)₂-、カルボシクリルアルキル-S(=O)₂-、ヘテロカルボシクリルアルキル-S(=O)₂-、 $C_1 - C_{10}$ アルキル-NHC(=O)-、カルボシクリル-NHC(=O)-、ヘテロカルボシクリル-NHC(=O)-、カルボシクリルアルキル-NHC(=O)-、ヘテロカルボシクリルアルキル-NHC(=O)-

(=O) -、 $C_1 - C_{10}$ アルキル - OC (=O) -、カルボシクリル - OC (=O) -、ヘテロカルボシクリル - OC (=O) -、カルボシクリルアルキル - OC (=O) -、ヘテロカルボシクリルアルキル - OC (=O) -、 $C_1 - C_{10}$ アルキル - NH - C (=O) - NHS (=O)₂ -、カルボシクリル - NH - C (=O) - NHS (=O)₂ -、ヘテロカルボシクリル - NH - C (=O) - NHS (=O)₂ -、 $C_1 - C_{10}$ アルキル - S (=O)₂ - NH - C (=O) -、カルボシクリル - S (=O)₂ - NH - C (=O) -、ヘテロカルボシクリル - S (=O)₂ - NH - C (=O) -、またはアミノ保護基であり、 R^{10} は選択的に 1、2、または 3 個の R^{23} で置換されており、
或いは、 R^9 および R^{10} は N 原子と共に結合して選択的に 1、2、または 3 個の R^{23} で置換されたヘテロカルボシクリル基を形成し、

Y は H、-CN、-NO₂、-S (=O)₂ R^{11} 、またはグアニジノ保護基であり；

R^{11} は $C_1 - C_6$ アルキル、アリール、または $NR^{12} R^{13}$ であり；

R^{12} および R^{13} は個別に H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、カルボシクリル、ヘテロカルボシクリル、またはアミノ保護基であり、

或いは、 R^{12} および R^{13} は N 原子と共に結合してヘテロカルボシクリル基を形成し

Z は O、S、Se、または Te であり、

Q は -B (OH)₂、-B (OR¹⁴)₂、またはサイクリックボロン酸エステルであり、前記サイクリックボロン酸エステルは 2 ~ 20 個の炭素原子と、選択的に N、S、または O のヘテロ原子とを含み、

R^{14} は H、 $C_1 - C_4$ アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、またはアラルキルであり、

X は $R^A C (=O) -$ 、 $R^A NHC (=O) -$ 、 $R^A S (=O)_2 -$ 、 $R^A OC (=O) -$ 、 $R^A SC (=O) -$ 、または R^A であり、

R^A は、選択的に R^{20} で置換された $C_1 - C_{20}$ アルキル、選択的に R^{20} で置換された $C_2 - C_{20}$ アルケニル、選択的に R^{20} で置換された $C_2 - C_{20}$ アルキニル、1 ~ 5 個の R^{21} で選択的に置換されたカルボシクリル、または 1 ~ 5 個の R^{21} で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され、

R^{20} は、-CN、ハロ、ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、-CO₂H、-C (=O) CO₂H、-C (=O) NH₂、-C (=O) H、-S (=O) NH₂、-S (=O)₂ NH₂、-OH、-SH、-NH₂、-NH (アルキル)、-N (アルキル)₂、-NHC (=O) NH₂、-NHC (=O) R^{20a} 、-NHC (=O) OR^{20a}、-OR^{20a}、-SR^{20a}、-S (=O) R^{20a} 、-S (=O)₂ R^{20a} 、-S (=O)₂ -NHR^{20a}、-SC (=O) R^{20a} 、-C (=O) R^{20a} 、-C (=O) NHR^{20a}、-C (=O) O- R^{20a} 、-NHS (=O)₂ R^{20a} 、-NHR^{20b}、フタルイミド、-(O-アルキル)_r-OH、-(O-アルキル)_r-(O-アルキル)、-OR^{20c}、-SR^{20c}、-O-アルキル- R^{20c} 、-S-アルキル- R^{20c} 、-S (=O)- R^{20c} 、-S (=O)₂- R^{20c} 、-S (=O)₂-NHR^{20c}、-SC (=O) R^{20c} 、-C (=O) R^{20c} 、-C (=O) OR^{20c}、-C (=O) NHR^{20c}、1 ~ 5 個の R^{21} で選択的に置換されたカルボシクリル、および 1 ~ 5 個の R^{21} で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され；

R^{20a} は、 $C_1 - C_{20}$ アルキル、 $C_2 - C_{20}$ アルケニル、または $C_2 - C_{20}$ アルキニルであり、前記アルキル、アルケニル、またはアルキニルは選択的に 1 若しくはそれ以上のハロ、OH、CN、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_2 - C_8$ アルコシアルコキシ、アリールヘテロアリール、または -NHR^{20b} で置換されており

R^{20b} はアミノ保護基であり、

R^{20c} は 1 ~ 5 個の R^{21} で選択的に置換されたカルボシクリル、または 1 ~ 5 個の R^{22} で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルであり、

$R^{2\ 1}$ は、 $C_1 - C_{20}$ アルキル、 $C_2 - C_{20}$ アルケニル、 $C_2 - C_{20}$ アルキニル、 $-OR^{2\ 1\ a}$ 、 $-SR^{2\ 1\ a}$ 、 $-CN$ 、ハロ、ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH$ (アルキル)、 $-N$ (アルキル) $_2$ 、 $-NHC(=O)O$ -アルキル、 $-NHC(=O)$ アルキル、 $-COOH$ 、 $-C(=O)O$ -アルキル、 $-C(=O)$ アルキル、 $-C(O)H$ 、 $-S(=O)$ -アルキル、 $-S(=O)_2$ -アルキル、 $-S(=O)$ -アリール、 $-S(=O)_2$ -アリール、1～5個の $R^{2\ 2}$ で選択的に置換されたカルボシクリル、および1～5個の $R^{2\ 2}$ で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され、

$R^{2\ 1\ a}$ はH、 $C_1 - C_{20}$ アルキル、 $C_2 - C_{20}$ アルケニル、 $C_2 - C_{20}$ アルキニル、カルボシクリルまたはヘテロカルボシクリルであり、

$R^{2\ 2}$ は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、フェニル、ハロ、ハロアルキル、アルコキシ、チアルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、カルボキシル、アルキル- $OC(=O)-$ 、アルキル- $C(=O)-$ 、アリール- $OC(=O)-$ 、アルキル- $OC(=O)NH-$ 、アリール- $OC(=O)NH-$ 、アルキル- $C(=O)NH-$ 、アルキル- $C(=O)O-$ 、(アルキル- O) $_r$ -アルキル、 $HO-(アルキル-O)_r$ -アルキル、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-N_3$ 、 $-CNO$ 、 $-CNS$ 、アルキル- $S(=O)-$ 、アルキル- $S(=O)_2-$ 、 $H_2NS(=O)-$ 、または $H_2NS(=O)_2-$ から成る群から選択され、

$R^{2\ 3}$ は、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、F、Cl、Br、I、ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{2\ 3\ a}$ 、 $-N(R^{2\ 3\ a})_2$ 、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CNO$ 、 $-CNS$ 、 $-C(=O)OR^{2\ 3\ a}$ 、 $-C(=O)R^{2\ 3\ a}$ 、 $-OC(=O)R^{2\ 3\ a}$ 、 $-N(R^{2\ 3\ a})C(=O)R^{2\ 3\ a}$ 、 $-N(R^{2\ 3\ a})C(=O)OR^{2\ 3\ a}$ 、 $-C(=O)N(R^{2\ 3\ a})_2$ 、ウレイド、 $-OR^{2\ 3\ a}$ 、 $-SR^{2\ 3\ a}$ 、 $-S(=O)-(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-S(=O)_2-(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-S(=O)$ -アリール、 $-S(=O)_2$ -アリール、 $-S(=O)_2-N(R^{2\ 3\ a})_2$ 、1～5個の $R^{2\ 4}$ で選択的に置換されたカルボシクリル、および1～5個の $R^{2\ 4}$ で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され、

$R^{2\ 3\ a}$ はHまたは $C_1 - C_6$ アルキルであり、

或いは、2つの $R^{2\ 3\ a}$ がN原子と結合して5～7員環の複素環基を形成してもよく、

$R^{2\ 4}$ は、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、フェニル、ハロ、ハロアルキル、アルコキシ、チアルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、カルボキシル、アルキル- $OC(=O)-$ 、アルキル- $C(=O)-$ 、アリール- $OC(=O)-$ 、アルキル- $OC(=O)NH-$ 、アリール- $OC(=O)NH-$ 、アルキル- $C(=O)NH-$ 、アルキル- $C(=O)O-$ 、(アルキル- O) $_r$ -アルキル、 $HO-(アルキル-O)_r$ -アルキル、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-N_3$ 、 $-CNO$ 、 $-CNS$ 、アルキル- $S(=O)-$ 、アルキル- $S(=O)_2-$ 、 $H_2NS(=O)-$ 、または $H_2NS(=O)_2-$ から成る群から選択され、

r は1、2、3、4、5、6、7、8、9、または10であり、

ただし、Qが1, 1, 2, 2-テトラメチルエタンジオールボロン酸エステルの時、Xはアラロキロキシカルボニルであり、

Qが1, 1, 2, 2-テトラメチルエタンジオールボロン酸エステル、 R^1 がシクロアルキルの時、 R^2 は $-CH_2CONH_2$ ではなく、

ただし、Xが $R^A C(=O)-$ 、 R^A が $R^{2\ 0}$ で置換された $C_4 - C_{15}$ 直鎖アルキルであり、 $R^{2\ 0}$ が $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、 $-C(=O)O-R^{2\ 0\ a}$ 、 $-NHS(=O)_2$ 、 $R^{2\ 0\ a}$ 、 $-NHC(=O)R^{2\ 0\ a}$ 、 $-NHR^{2\ 0\ b}$ 、またはフタルイミドの時に、 R^2 は $-(CH_2)_aCH_2NHC(=NR^4)NH-Y$ ではなく、YはH、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、またはグアニジノ保護基である、化合物。

【請求項2】

請求項1記載の化合物において、 R^1 は $C_1 - C_4$ アルキルである。

【請求項3】

請求項1記載の化合物において、 R^1 は2-プロピルである。

【請求項 4】

請求項 1 記載の化合物において、 R^2 は $-(CH_2)_a CH_2 NHC(=NR^4)NH$
 $-Y$ 、 $-(CH_2)_b CH_2 CONR^5 R^6$ 、 $-(CH_2)_c CH_2 N(R^4)CONH$
 2 、 $-(CH_2)_d CH(R^7)NR^9 R^{10}$ 、または $-(CH_2)_e CH(R^7)ZR^8$
 8 である。

【請求項 5】

請求項 1 記載の化合物において、 R^2 は $-(CH_2)_a CH_2 NHC(=NR^4)NH$
 $-Y$ である。

【請求項 6】

請求項 5 記載の化合物において、 a は 1、2、3、または 4 である。

【請求項 7】

請求項 5 記載の化合物において、 a は 2 である。

【請求項 8】

請求項 1 記載の化合物において、 R^2 は $-(CH_2)_d CH(R^7)NR^9 R^{10}$ であ
 る。

【請求項 9】

請求項 8 記載の化合物において、 d は 0、1、または 2 である。

【請求項 10】

請求項 8 記載の化合物において、 d は 0 である。

【請求項 11】

請求項 8 記載の化合物において、 R^2 は H である。

【請求項 12】

請求項 1 記載の化合物において、 R^2 は $-(CH_2)_e CH(R^7)ZR^8$ である。

【請求項 13】

請求項 12 記載の化合物において、 Z は O である。

【請求項 14】

請求項 13 記載の化合物において、 e は 0、1、または 2 である。

【請求項 15】

請求項 13 記載の化合物において、 e は 0 である。

【請求項 16】

請求項 1 記載の化合物において、 Q は $B(OH)_2$ またはサイクリックボロン酸エステ
 ルであり、前記サイクリックボロン酸エステルは 6～10 個の炭素原子を含み、少なくと
 も 1 つのシクロアルキル部分を含むものである。

【請求項 17】

請求項 16 記載の化合物において、 Q はピナンジオールボロン酸である。

【請求項 18】

請求項 16 記載の化合物において、 Q はビスクロヘキシル-1，1'-ジオールボロン
 酸エステルである。

【請求項 19】

請求項 16 記載の化合物において、 Q は 1，2-ジクロヘキシル-エタン-1，2-
 ジオールボロン酸エステルである。

【請求項 20】

請求項 1 記載の化合物において、 X は $R^A C(=O)-$ である。

【請求項 21】

請求項 1 記載の化合物において、 X は $R^A NHC(=O)-$ である。

【請求項 22】

請求項 1 の化合物において、 X は $R^A S(=O)_2-$ である。

【請求項 23】

請求項 1 記載の化合物において、 R^A は $-(O-アルキル)_r-OH$ または $-(O-ア
 ルキル)_r-(O-アルキル)$ で置換された C_1-C_{14} アルキルであり、 r は 1、2、

3、4、または5である。

【請求項24】

請求項23記載の化合物において、 R^A は $-(O-アルキル)_r-OH$ 、 $-(O-アルキル)_r-(O-アルキル)$ で置換された C_1-C_{14} アルキルであり、 r は1、2または3である。

【請求項25】

請求項23記載の化合物において、 R^A は少なくとも1つの $-CH_2CH_2O-$ 基を有する。

【請求項26】

請求項23記載の化合物において、 R^A は $-CH_2(OCH_2CH_2)_rOCH_3$ である。

【請求項27】

請求項23記載の化合物において、 R^A は $-CH_2OCH_2CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ または $-CH_2OCH_2CH_2OCH_3$ である。

【請求項28】

請求項1記載の化合物において、 R^A はそれぞれ選択的に1～5個の R^{21} で置換されたアリールまたはヘテロアリールである。

【請求項29】

請求項1記載の化合物において、 R^A はそれぞれ選択的に1～5個の R^{21} で置換されたシクロアルキルまたはヘテロシクロアルキルである。

【請求項30】

請求項1記載の化合物において、 R^A は C_1-C_{20} アルキル、 C_2-C_{20} アルケニル、または C_2-C_{20} アルキニルであり、それぞれ選択的に R^{20} で置換されているものである。

【請求項31】

請求項1記載の化合物において、 R^A はそれぞれカルボシクリル基またはヘテロカルボシクリル基で置換された C_1-C_{20} アルキル、 C_2-C_{20} アルケニル、または C_2-C_{20} アルキニルであり、前記カルボシクリル基またはヘテロカルボシクリル基は選択的に1、2、または3個の R^{21} で置換されているものである。

【請求項32】

請求項1記載の化合物において、 R^A はそれぞれアリール基で置換された C_1-C_{20} アルキル、 C_2-C_{20} アルケニル；または C_2-C_{20} アルキニルであり、前記アリール基は選択的に1、2、または3個の R^{21} で置換されているものである。

【請求項33】

請求項1記載の化合物において、 R^A はそれぞれヘテロアリール基で置換された C_1-C_{20} アルキル、 C_2-C_{20} アルケニル、または C_2-C_{20} アルキニルであり、前記ヘテロアリール基は選択的に1、2、または3個の R^{21} で置換されているものである。

【請求項34】

請求項1の化合物において、 R^A はそれぞれシクロアルキル基で置換された C_1-C_{20} アルキル、 C_2-C_{20} アルケニル、または C_2-C_{20} アルキニルであり、前記シクロアルキル基は選択的に1、2、または3個の R^{21} で置換されるものである。

【請求項35】

請求項1記載の化合物において、 R^A はそれぞれヘテロシクロアルキル基で置換された C_1-C_{20} アルキル、 C_2-C_{20} アルケニル、または C_2-C_{20} アルキニルであり、前記ヘテロシクロアルキル基は選択的に1、2、または3個の R^{21} で置換されているものである。

【請求項36】

請求項1記載の化合物において、 R^2 は $-CH_2NH-C(=O)OCH_2(C_6H_5)$ である。

【請求項37】

請求項 1 記載の化合物において、 R^A はそれぞれ選択的に R^{20} で置換された $C_1 - C_{20}$ アルキル、 $C_2 - C_{20}$ アルケニル、または $C_2 - C_{20}$ アルキニルであり、 R^{20} は CN 、ハロ、ハロアルキル、 $-CO_2H$ 、 $-C(=O)CO_2H$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)H$ 、 $-S(=O)NH_2$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH$ (アルキル)、 $-N$ (アルキル) $_2$ 、 $-NHC(=O)NH_2$ 、 $-NHC(=O)R^{20a}$ 、 $-NHC(=O)OR^{20a}$ 、 $-OR^{20a}$ 、 $-SR^{20a}$ 、 $-S(=O)R^{20a}$ 、 $-S(=O)_2R^{20a}$ 、 $-S(=O)_2-NHR^{20a}$ 、 $-SC(=O)R^{20a}$ 、 $-C(=O)R^{20a}$ 、 $-C(=O)NHR^{20a}$ 、 $-C(=O)O-R^{20a}$ 、 $-NHS(=O)_2R^{20a}$ 、 $-NHR^{20b}$ 、フタルイミド、 $-(O-アルキル)$ 、 $-(O-アルキル)_r-OH$ 、 $-(O-アルキル)_r-(O-アルキル)$ 、 $-OR^{20c}$ 、 $-SR^{20c}$ 、 $-O-アルキル-R^{20c}$ 、 $-S-アルキル-R^{20c}$ 、 $-S(=O)-R^{20c}$ 、 $-S(=O)_2-R^{20c}$ 、 $-S(=O)_2-NHR^{20c}$ 、 $-SC(=O)R^{20c}$ 、 $-C(=O)R^{20c}$ 、 $-C(=O)OR^{20c}$ 、 $-C(=O)NHR^{20c}$ から選択されるものである。

【請求項 38】

請求項 1 記載の化合物において、 R^2 は H であり、 X は $(O-アルキル)-(O-アルキル)_r-(C_1-C_{14}$ アルキル) $-C(=O)-$ または $HO-(アルキル-O)_r-(C_1-C_{14}$ アルキル) $-C(=O)-$ である。

【請求項 39】

請求項 1 記載の化合物において、 X は $R^A C(=O)-$ であり、 R^A は C_4-C_{16} アルキルである。

【請求項 40】

請求項 1 記載の化合物において、 X は $R^A C(=O)-$ であり、 R^A は選択的に 1 ～ 3 個の R^{21} で置換されたアリールである。

【請求項 41】

請求項 1 記載の化合物において、 X は $R^A C(=O)-$ であり、 R^A は 1 つの R^{21} で置換されたフェニルであり、 R^{21} はフェノキシである。

【請求項 42】

請求項 1 記載の化合物において、 X は $R^A C(=O)-$ 、 R^A は R^{20} で置換された C_1-C_4 アルキル、 R^{20} は選択的に 1 ～ 3 個の R^{21} で置換されたアリールである。

【請求項 43】

請求項 40 記載の化合物において、アリールは少なくとも 1 つのハロで置換されるものである。

【請求項 44】

請求項 1 記載の化合物において、 X は $R^A C(=O)-$ であり、 R^A は R^{20} で置換された C_1-C_{14} アルキルであり、 R^{20} は $-OR^{20a}$ または $-OR^{20c}$ である。

【請求項 45】

請求項 1 記載の化合物において、 X は $R^A C(=O)-$ 、 R^A は R^{20} で置換された C_1-C_4 アルキル、 R^{20} は選択的に 1 ～ 3 個の R^{21} で置換されたヘテロカルボシクリルである。

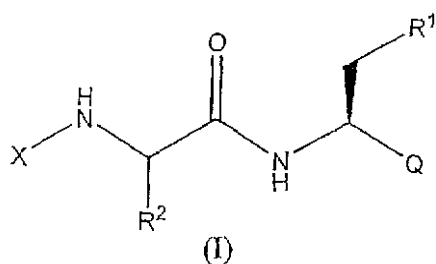
【請求項 46】

請求項 1 記載の化合物において、 X は $R^A S(O)_2-$ であり、 R^A は C_3-C_{16} アルキルである。

【請求項 47】

化学式 (I) の化合物、

【化 2】



または薬学的に許容可能なその塩、その立体異性体、またはその互変異性体であって、
 R^1 は $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、または $C_3 - C_7$ シクロアルキルであり、
 R^2 は H 、 $-(CH_2)_a CH_2 NHC(=NR^4)NH-Y$ 、 $-(CH_2)_b CH_2 CONR^5 R^6$ 、 $-(CH_2)_c CH_2 N(R^4)CONH_2$ 、 $-(CH_2)_d CH(R^7)NR^9 R^{10}$ 、または $-(CH_2)_e CH(R^7)ZR^8$ であり、
 a 、 b 、および c はそれぞれ個別に 0 、 1 、 2 、 3 、 4 、 5 、または 6 から選択され、
 d および e はそれぞれ個別に 0 、 1 、 2 、 3 、または 4 から選択され、
 R^4 は H または $C_1 - C_{10}$ アルキルであり、
 R^5 および R^6 はそれぞれ個別に H 、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、カルボシクリル、ヘテロカルボシクリル、またはアミノ保護基であり、
 或いは、 R^5 および R^6 は N 原子と共にヘテロカルボシクリル基を形成し、
 R^7 は H または $C_1 - C_{10}$ アルキルであり、
 R^8 は H 、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、アルキル- $S(=O)_2-$ 、アリール- $S(=O)_2-$ 、 $H_2NS(=O)_2-$ 、 $-SO_3H$ 、または保護基であり、
 R^9 は H 、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、カルボシクリル、またはヘテロカルボシクリルであり、
 R^{10} は H 、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、カルボシクリル、ヘテロカルボシクリル、 $C_1 - C_{10}$ アルキル- $C(=O)-$ 、カルボシクリル- $C(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリル- $C(=O)-$ 、カルボシクリルアルキル- $C(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリルアルキル- $C(=O)-$ 、 $C_1 - C_{10}$ アルキル- $S(=O)_2-$ 、カルボシクリル- $S(=O)_2-$ 、ヘテロカルボシクリル- $S(=O)_2-$ 、カルボシクリルアルキル- $S(=O)_2-$ 、ヘテロカルボシクリルアルキル- $S(=O)_2-$ 、 $C_1 - C_{10}$ アルキル- $NHC(=O)-$ 、カルボシクリル- $NHC(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリル- $NHC(=O)-$ 、カルボシクリルアルキル- $NHC(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリルアルキル- $NHC(=O)-$ 、 $C_1 - C_{10}$ アルキル- $OC(=O)-$ 、カルボシクリル- $OC(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリル- $OC(=O)-$ 、カルボシクリルアルキル- $OC(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリルアルキル- $OC(=O)-$ 、またはアミノ保護基であり、
 R^{10} は 選択的に 1 、 2 、または 3 個の R^{23} で置換されており、
 或いは、 R^9 および R^{10} は N 原子と共にヘテロカルボシクリル基を形成し、
 Y は H 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-S(=O)_2 R^{11}$ 、またはグアニジノ保護基であり、
 R^{11} は $C_1 - C_6$ アルキル、アリール、または $NR^{12} R^{13}$ であり、
 R^{12} および R^{13} は 個別に H 、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、カルボシクリル、ヘテロカルボシクリル、またはアミノ保護基であり、
 或いは、 R^{12} および R^{13} は N 原子と共にヘテロカルボシクリル基を形成し、
 Z は O 、 S 、 Se 、または Te であり、
 Q は $-B(OH)_2$ 、 $-B(OR^{14})_2$ 、またはサイクリックボロン酸エステルであり、前記サイクリックボロン酸エステルは $2 \sim 20$ 個の炭素原子と、選択的に N 、 S 、または O のヘテロ原子とを含み、
 R^{14} は H 、 $C_1 - C_4$ アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリー

ル、またはアラルキルであり、

Xは $R^A C(=O)-$ 、 $R^A NHC(=O)-$ 、 $R^A S(=O)_2-$ 、 $R^A OC(=O)-$ 、 $R^A SC(=O)-$ 、または R^A であり、

R^A は選択的に R^{20} で置換された C_1-C_{20} アルキル、選択的に R^{20} で置換された C_2-C_{20} アルケニル、選択的に R^{20} で置換された C_2-C_{20} アルキニル、1～5個の R^{21} で選択的に置換されたカルボシクリル、または1～5個の R^{21} で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルであり、

R^{20} は、 $-CN$ 、ハロ、ハロアルキル、 C_1-C_4 アルキル、 C_2-C_4 アルケニル、 C_2-C_4 アルキニル、 $-CO_2H$ 、 $-C(=O)CO_2H$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)H$ 、 $-S(=O)NH_2$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH$ (アルキル)、 $-N$ (アルキル) $_2$ 、 $-NHC(=O)NH_2$ 、 $-NHC(=O)R^{20a}$ 、 $-NHC(=O)OR^{20a}$ 、 $-OR^{20a}$ 、 $-SR^{20a}$ 、 $-S(=O)R^{20a}$ 、 $-S(=O)_2R^{20a}$ 、 $-S(=O)_2-NHR^{20a}$ 、 $-SC(=O)R^{20a}$ 、 $-C(=O)R^{20a}$ 、 $-C(=O)NHR^{20a}$ 、 $-C(=O)O-R^{20a}$ 、 $-NHS(=O)_2R^{20a}$ 、 $-NHR^{20b}$ 、フタルイミド、 $-(O-アルキル)_r$ 、 $-O-アルキル-OH$ 、 $-(O-アルキル)_r-OH$ 、 $-OR^{20c}$ 、 $-SR^{20c}$ 、 $-O-アルキル-R^{20c}$ 、 $-S-アルキル-R^{20c}$ 、 $-S(=O)-R^{20c}$ 、 $-S(=O)_2-R^{20c}$ 、 $-S(=O)_2-NHR^{20c}$ 、 $-SC(=O)R^{20c}$ 、 $-C(=O)R^{20c}$ 、 $-C(=O)OR^{20c}$ 、 $-C(=O)NHR^{20c}$ 、1～5個の R^{21} で選択的に置換されたカルボシクリル、および1～5個の R^{21} で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され、

R^{20a} は、 C_1-C_{20} アルキル、 C_2-C_{20} アルケニル、または C_2-C_{20} アルキニルであり、前記アルキル、アルケニル、またはアルキニルは選択的に1若しくはそれ以上のハロ、 C_1-C_4 アルキル、アリール、ヘテロアリールまたは $-NHR^{20b}$ で置換され、

R^{20b} はアミノ保護基であり、

R^{20c} は1～5個の R^{21} で選択的に置換されたカルボシクリル、または1～5個の R^{22} で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルであり、

R^{21} は、 C_1-C_{20} アルキル、 C_2-C_{20} アルケニル、 C_2-C_{20} アルキニル、 C_1-C_{20} アルコキシ、 C_1-C_{20} チアルコキシ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、ハロ、ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH$ (アルキル)、 $-N$ (アルキル) $_2$ 、 $-NHC(=O)O-アルキル$ 、 $-NHC(=O)アルキル$ 、 $-C(=O)O-アルキル$ 、 $-C(=O)アルキル$ 、 $-S(=O)-アルキル$ 、 $-S(=O)_2-アルキル$ 、 $-S(=O)-アリール$ 、 $-S(=O)_2-アリール$ 、1～5個の R^{22} で選択的に置換されたカルボシクリル、および1～5個の R^{22} で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され、

R^{22} は、 C_1-C_{10} アルキル、 C_2-C_{10} アルケニル、 C_2-C_{10} アルキニル、フェニル、ハロ、ハロアルキル、アルコキシ、チアルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、カルボキシル、アルキル- $OC(=O)-$ 、アルキル- $C(=O)-$ 、アリール- $OC(=O)-$ 、アルキル- $OC(=O)NH-$ 、アリール- $OC(=O)NH-$ 、アルキル- $C(=O)NH-$ 、アルキル- $C(=O)O-$ 、(アルキル- O) $_r$ -アルキル、 $HO-(アルキル-O)_r$ -アルキル、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-N_3$ 、 $-CNO$ 、 $-CNS$ 、アルキル- $S(=O)-$ 、アルキル- $S(=O)_2-$ 、 $H_2NS(=O)-$ 、または $H_2NS(=O)_2-$ から成る群から選択され、

R^{23} は、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{23a}$ 、 $-N(R^{23a})_2$ 、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CNO$ 、 $-CNS$ 、 $-C(=O)OR^{23a}$ 、 $-C(=O)R^{23a}$ 、 $-OC(=O)R^{23a}$ 、 $-N(R^{23a})C(=O)R^{23a}$ 、 $-C(=O)N(R^{23a})_2$ 、ウレイド、 $-OR^{23a}$ 、 $-SR^{23a}$ 、 $-S(=O)_2-(C_1-C_6アルキル)$ 、 $-S(=O)_2-アリール$ 、および $-S(=O)_2-N(R^{23a})_2$ から成る群から選択され、

$R^{2\ 3\ a}$ は H または C_{1-10} アルキルであり、
 或いは、2つの $R^{2\ 3\ a}$ は前記 N 原子と共に結合して 5 ～ 7 員環の複素環基を形成してもよく、

r は 2、3、4、5、6、7、8、9、または 10 であり、

ただし、Q が 1, 1, 2, 2-テトラメチルエタンジオールボロン酸エステルの時、X はアラルキロキシカルボニルであり、

Q が 1, 1, 2, 2-テトラメチルエタンジオールボロン酸エステル、 R^1 がシクロアルキルの時、 R^2 は $-CH_2CONH_2$ ではなく、

X が $R^A C(=O)-$ 、 R^A が $R^{2\ 0}$ で置換された C_{4-15} 直鎖アルキルであり、 $R^{2\ 0}$ が $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、 $-C(=O)O-R^{2\ 0\ a}$ 、 $-NHS(O)_2R^{2\ 0\ a}$ 、 $-NHC(=O)R^{2\ 0\ a}$ 、 $-NHR^{2\ 0\ b}$ 、またはフタリイミドの時に、 R^2 は $-(CH_2)_aCH_2NHC(=NR^4)NH-Y$ ではなく、Y は H、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、またはグアニジノ保護基である、化合物。

【請求項 48】

請求項 47 記載の化合物において、 R^1 は 2-プロピルである。

【請求項 49】

請求項 47 記載の化合物において、Q は $-B(OH)_2$ である。

【請求項 50】

請求項 47 記載の化合物において、Q はピナジオールボロン酸である。

【請求項 51】

請求項 47 記載の化合物において、X は $R^A C(=O)-$ である。

【請求項 52】

請求項 47 記載の化合物において、 R^2 は $-CH_2NH-C(=O)OCH_2(C_6H_5)$ である。

【請求項 53】

請求項 47 記載の化合物において、X は $R^A C(=O)-$ であり、 R^A は C_{4-16} アルキルである。

【請求項 54】

請求項 47 記載の化合物において、X は $R^A C(=O)-$ であり、 R^A は選択的に 1 ～ 3 個の $R^{2\ 1}$ で置換されたアリールである。

【請求項 55】

請求項 47 記載の化合物において、X は $R^A C(=O)-$ であり、 R^A は選択的に 1 ～ 3 個の $R^{2\ 1}$ で置換されたヘテロカルボシクリル基である。

【請求項 56】

請求項 47 記載の化合物、薬学的に許容可能なその塩、その立体異性体、またはその互変異性体において、

R^1 は 2-プロピルであり、

R^2 は H、 $-(CH_2)_aCH_2NHC(=NR^4)NH-Y$ 、 $-(CH_2)_bCH_2CONR^5R^6$ 、 $-(CH_2)_cCH_2N(R^4)CONH_2$ 、 $-(CH_2)_dCH(R^7)NR^9R^{1\ 0}$ 、または $-(CH_2)_eCH(R^7)ZR^8$ であり、

Q は $-B(OH)_2$ またはピナジオールボロン酸エステルであり、

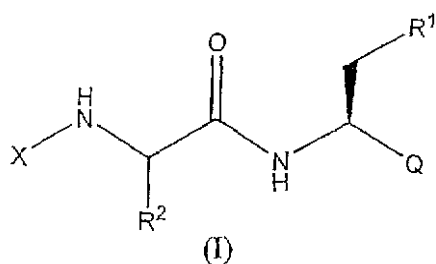
X は $R^A C(=O)-$ であり、

R^A は C_{4-16} アルキル、1 ～ 3 個の $R^{2\ 1}$ で選択的に置換されたアリール、または 1 ～ 3 個の $R^{2\ 1}$ で選択的に置換されたヘテロカルボシクリル基である。

【請求項 57】

化学式 (I) を有する請求項 1 記載の化合物、

【化 3】



または薬学的に許容可能なその塩、その立体異性体、またはその互変異性体において、
 R^1 は $C_1 - C_8$ アルキル、

R^2 は $-(CH_2)_a CH_2 NHC(=NH)NH-Y$ 、 $-(CH_2)_c CH_2 NHC ONH_2$ 、 $-(CH_2)_d CH(R^7)NR^9 R^{10}$ 、または $-(CH_2)_e CH(R^7)ZR^8$ であり、

a は 1、2、3、4、または 5 であり、

c は 1、2、3、4、または 5 であり、

d は 0、1、または 2 であり、

e は 0、1、または 2 であり、

R^7 は H または メチル であり、

R^8 は H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $-S(=O)_2$ -アルキル、 $-S(=O)_2$ -アリール、 $-S(=O)_2-NH_2$ 、 $-SO_3H$ 、または保護基であり、

Y は H、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-S(=O)_2 R^{11}$ 、またはグアニジノ保護基であり、

R^9 は H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、カルボシクリル、またはヘテロカルボシクリルであり、

R^{10} は H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、カルボシクリル、ヘテロカルボシクリル、 $C_1 - C_{10}$ アルキル- $C(=O)-$ 、カルボシクリル- $C(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリル- $C(=O)-$ 、カルボシクリルアルキル- $C(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリルアルキル- $C(=O)-$ 、 $C_1 - C_{10}$ アルキル- $S(=O)_2-$ 、カルボシクリル- $S(=O)_2-$ 、ヘテロカルボシクリル- $S(=O)_2-$ 、カルボシクリルアルキル- $S(=O)_2-$ 、ヘテロカルボシクリルアルキル- $S(=O)_2-$ 、 $C_1 - C_{10}$ アルキル- $NHC(=O)-$ 、カルボシクリル- $NHC(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリル- $NHC(=O)-$ 、カルボシクリルアルキル- $NHC(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリルアルキル- $NHC(=O)-$ 、 $C_1 - C_{10}$ アルキル- $OC(=O)-$ 、カルボシクリル- $OC(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリル- $OC(=O)-$ 、カルボシクリルアルキル- $OC(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリルアルキル- $OC(=O)-$ 、またはアミノ保護基であり、

R^{10} は選択的に 1、2、または 3 個の R^{23} で置換され、

或いは、 R^9 および R^{10} は N 原子と共にヘテロカルボシクリル基を形成し、

R^{11} は $C_1 - C_6$ アルキル、アリール、または $NR^{12} R^{13}$ であり、

R^{12} および R^{13} は個別に H、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、カルボシクリル、ヘテロカルボシクリル、またはアミノ保護基であり、

或いは、 R^{12} および R^{13} は N 原子と共にヘテロカルボシクリル基を形成し、

Z は O または S であり、

Q は $-B(OH)_2$ 、 $-B(OR^{14})_2$ 、またはサイクリックボロン酸エステルであり、前記サイクリックボロン酸エステルには 6～20 個の炭素原子と、少なくとも 1 つのシクロアルキル部分を含み、

R^{14} は H、 $C_1 - C_4$ アルキル、またはシクロアルキルであり、

X は $R^A C(=O)-$ 、 $R^A NHC(=O)-$ 、 $R^A S(=O)_2-$ 、 $R^A OC(=O)-$ 、 $R^A SC(=O)-$ 、または R^A であり、

R^A は選択的に R^{20} で置換された $C_1 - C_{20}$ アルキル、選択的に R^{20} で置換され

た $C_2 - C_{20}$ アルケニル、選択的に R^{20} で置換された $C_2 - C_{20}$ アルキニル、 $1 - 5 R^{21}$ で 選択的に 置換されたカルボシクリル、または 1 ～ 5 個の R^{21} で 選択的に 置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され、

R^{20} は、 $-CN$ 、ハロ、ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $-CO_2H$ 、 $-C(=O)CO_2H$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)H$ 、 $-S(=O)NH_2$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH$ (アルキル)、 $-N$ (アルキル) $_2$ 、 $-NHC(=O)NH_2$ 、 $-NHC(=O)R^{20a}$ 、 $-NHC(=O)OR^{20a}$ 、 $-OR^{20a}$ 、 $-SR^{20a}$ 、 $-S(=O)R^{20a}$ 、 $-S(=O)_2R^{20a}$ 、 $-S(=O)_2-NHR^{20a}$ 、 $-SC(=O)R^{20a}$ 、 $-C(=O)R^{20a}$ 、 $-C(=O)NHR^{20a}$ 、 $-C(=O)O-R^{20a}$ 、 $-NHS(=O)_2R^{20a}$ 、 $-NHR^{20b}$ 、フタルイミド、 $-(O-アルキル)_r$ 、 $-O-アルキル-OH$ 、 $-(O-アルキル)_r-OH$ 、 $-OR^{20c}$ 、 $-SR^{20c}$ 、 $-O-アルキル-R^{20c}$ 、 $-S-アルキル-R^{20c}$ 、 $-S(=O)-R^{20c}$ 、 $-S(=O)_2-R^{20c}$ 、 $-S(=O)_2-NHR^{20c}$ 、 $-SC(=O)R^{20c}$ 、 $-C(=O)R^{20c}$ 、 $-C(=O)OR^{20c}$ 、 $-C(=O)NHR^{20c}$ 、1 ～ 5 個の R^{21} で 選択的に 置換されたカルボシクリル、および 1 ～ 5 個の R^{21} で 選択的に 置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され、

R^{20a} は、 $C_1 - C_{20}$ アルキル、 $C_2 - C_{20}$ アルケニル、または $C_2 - C_{20}$ アルキニルであり、前記 アルキル、アルケニル、またはアルキニルは 選択的に 1 若しくはそれ以上のハロ、 $C_1 - C_4$ アルキル、アリール、ヘテロアリールまたは $-NHR^{20b}$ で置換され；

R^{20b} はアミノ保護基であり；

R^{20c} は 1 ～ 5 個の R^{21} で 選択的に 置換されたカルボシクリル、または 1 ～ 5 個の R^{22} で 選択的に 置換されたヘテロカルボシクリルであり、

R^{21} は、 $C_1 - C_{20}$ アルキル、 $C_2 - C_{20}$ アルケニル、 $C_2 - C_{20}$ アルキニル、 $C_1 - C_{20}$ アルコキシ、 $C_1 - C_{20}$ チアルコキシ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、ハロ、ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH$ (アルキル)、 $-N$ (アルキル) $_2$ 、 $-NHC(=O)O-アルキル$ 、 $-NHC(=O)アルキル$ 、 $-C(=O)O-アルキル$ 、 $-C(=O)アルキル$ 、 $-S(=O)-アルキル$ 、 $-S(=O)_2-アルキル$ 、 $-S(=O)-アリール$ 、 $-S(=O)_2-アリール$ 、1 ～ 5 個の R^{22} で 選択的に 置換されたカルボシクリル、および 1 ～ 5 個の R^{22} で 選択的に 置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され、

R^{22} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、フェニル、ハロ、ハロアルキル、アルコキシ、チアルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、カルボキシル、アルキル- $OC(=O)-$ 、アルキル- $C(=O)-$ 、アリール- $OC(=O)-$ 、アルキル- $OC(=O)NH-$ 、アリール- $OC(=O)NH-$ 、アルキル- $C(=O)NH-$ 、アルキル- $C(=O)O-$ 、 $(アルキル-O)_r-アルキル$ 、 $HO-(アルキル-O)_r-アルキル$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-N_3$ 、 $-CNO$ 、 $-CNS$ 、アルキル- $S(=O)-$ 、アルキル- $S(=O)_2-$ 、 $H_2NS(=O)-$ 、または $H_2NS(=O)_2-$ から成る群から選択され、

R^{23} は、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{23a}$ 、 $-N(R^{23a})_2$ 、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CNO$ 、 $-CNS$ 、 $-C(=O)OR^{23a}$ 、 $-C(=O)R^{23a}$ 、 $-OC(=O)R^{23a}$ 、 $-N(R^{23a})C(=O)R^{23a}$ 、 $-C(=O)N(R^{23a})_2$ 、ウレイド、 $-OR^{23a}$ 、 $-SR^{23a}$ 、 $-S(=O)_2-(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-S(=O)_2-アリール$ 、および $-S(=O)_2-N(R^{23a})_2$ から成る群から選択され、

R^{23} は H または $C_1 - C_{10}$ アルキルであり、

或いは、 2 つの R^{23a} は N 原子と 共に結合して $5 \sim 7$ 員環の複素環基を形成してもよく、

r は 2 、 3 、 4 、 5 、 6 、 7 、 8 、 9 、または 10 であり、

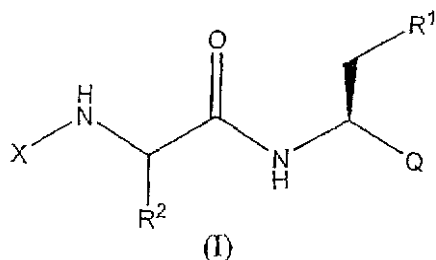
ただし、Xが $R^A C(=O)-$ 、 R^A が R^{20} で置換された C_4-C_{15} 直鎖アルキルであり、

R^{20} が $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、 $-C(=O)O-R^{20a}$ 、 $-NHS(=O)_2R^{20a}$ 、 $-NHC(=O)R^{20a}$ 、 $-NHR^{20b}$ 、またはフタルイミドの時に、 R^2 は $-(CH_2)_aCH_2NHC(=NR^4)NH-Y$ ではなく、YはH、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、またはグアニジノ保護基である。

【請求項58】

化学式(I)を有する請求項1記載の化合物、

【化4】



または薬学的に許容可能なその塩、その立体異性体、またはその互変異性体において、

R^1 は C_1-C_4 アルキルであり、

R^2 は $-(CH_2)_aCH_2NHC(=NH)NH-Y$ 、 $-(CH_2)_cCH_2NHC(=O)NH_2$ 、または $-(CH_2)_dCH(R^7)NR^9R^{10}$ であり、

aは1、2、または3であり、

cは1、2、または3であり、

dは0または1であり、

R^7 はHまたはメチルであり、

R^9 はHまたは C_1-C_{10} アルキルであり、

R^{10} はH、 C_1-C_{10} アルキル、またはアミノ保護基であり、

YはH、CN、または NO_2 であり、

Qは $-B(OH)_2$ 、ピナングオールボロン酸エステル、ビスクロヘキシル-1,1'-ジオールボロン酸エステル、または1,2-ジクロヘキシル-エタン-1,2-ジオールボロン酸エステルであり、

Xは $R^A C(=O)-$ 、 $R^A NHC(=O)-$ 、 $R^A S(=O)_2-$ 、 $R^A OC(=O)-$ 、 $R^A SC(=O)-$ 、または R^A であり、

R^A は選択的に R^{20} で置換された C_1-C_{20} アルキル、選択的に R^{20} で置換された C_2-C_{20} アルケニル、選択的に R^{20} で置換された C_2-C_{20} アルキニル、1~5個の R^{21} で選択的に置換されたカルボシクリル、または1~5個の R^{21} で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され、

R^{20} は、 $-CN$ 、ハロ、ハロアルキル、 C_1-C_4 アルキル、 C_2-C_4 アルケニル、 C_2-C_4 アルキニル、 $-CO_2H$ 、 $-C(=O)CO_2H$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)H$ 、 $-S(=O)NH_2$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH$ (アルキル)、 $-N$ (アルキル) $_2$ 、 $-NHC(=O)NH_2$ 、 $-NHC(=O)R^{20a}$ 、 $-NHC(=O)OR^{20a}$ 、 $-OR^{20a}$ 、 $-SR^{20a}$ 、 $-S(=O)R^{20a}$ 、 $-S(=O)_2R^{20a}$ 、 $-S(=O)_2-NHR^{20a}$ 、 $-SC(=O)R^{20a}$ 、 $-C(=O)R^{20a}$ 、 $-C(=O)NHR^{20a}$ 、 $-C(=O)O-R^{20a}$ 、 $-NHS(=O)_2R^{20a}$ 、 $-NHR^{20b}$ 、フタルイミド、 $-(O-アルキル)_r$ 、 $-O-アルキル-OH$ 、 $-(O-アルキル)_r-OH$ 、 $-OR^{20c}$ 、 $-SR^{20c}$ 、 $-O-アルキル-R^{20c}$ 、 $-S-アルキル-R^{20c}$ 、 $-S(=O)-R^{20c}$ 、 $-S(=O)_2-R^{20c}$ 、 $-S(=O)_2-NHR^{20c}$ 、 $-SC(=O)R^{20c}$ 、 $-C(=O)R^{20c}$ 、 $-C(=O)OR^{20c}$ 、 $-C(=O)NHR^{20c}$ 、1~5個

の $R^{2\ 1}$ で 選択的に置換されたカルボシクリル、および 1 ～ 5 個の $R^{2\ 1}$ で 選択的に置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され、

$R^{2\ 0\ a}$ は $C_1 - C_{20}$ アルキル、 $C_2 - C_{20}$ アルケニル、または $C_2 - C_{20}$ アルキニルであり、前記アルキル、アルケニル、またはアルキニルは 選択的に 1 若しくはそれ以上のハロ、 $C_1 - C_4$ アルキル、アリール、ヘテロアリールまたは $-NHR^{2\ 0\ b}$ で置換され、

$R^{2\ 0\ b}$ はアミノ保護基であり、

$R^{2\ 0\ c}$ は 1 ～ 5 個の $R^{2\ 1}$ で 選択的に置換されたカルボシクリル、または 1 ～ 5 個の $R^{2\ 2}$ で 選択的に置換されたヘテロカルボシクリルであり、

$R^{2\ 1}$ は、 $C_1 - C_{20}$ アルキル、 $C_2 - C_{20}$ アルケニル、 $C_2 - C_{20}$ アルキニル、 $C_1 - C_{20}$ アルコキシ、 $C_1 - C_{20}$ チアルコキシ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、ハロ、ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH$ (アルキル)、 $-N$ (アルキル) $_2$ 、 $-NHC(=O)O$ -アルキル、 $-NHC(=O)$ アルキル、 $-C(=O)O$ -アルキル、 $-C(=O)$ アルキル、 $-S(=O)$ -アルキル、 $-S(=O)_2$ -アルキル、 $-S(=O)$ -アリール、 $-S(=O)_2$ -アリール、1 ～ 5 個の $R^{2\ 2}$ で 選択的に置換されたカルボシクリル、および 1 ～ 5 個の $R^{2\ 2}$ で 選択的に置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され、

$R^{2\ 2}$ は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、フェニル、ハロ、ハロアルキル、アルコキシ、チアルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、カルボキシル、アルキル- $OC(=O)-$ 、アルキル- $C(=O)-$ 、アリール- $OC(=O)-$ 、アルキル- $OC(=O)NH-$ 、アリール- $OC(=O)NH-$ 、アルキル- $C(=O)NH-$ 、アルキル- $C(=O)O-$ 、(アルキル- O) $_r$ -アルキル、 $HO-(アルキル-O)_r$ -アルキル、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-N_3$ 、 $-CNO$ 、 $-CNS$ 、アルキル- $S(=O)-$ 、アルキル- $S(=O)_2-$ 、 $H_2NS(=O)-$ 、または $H_2NS(=O)_2-$ から成る群から選択され、

r は 2、3、4、または 5 であり、

ただし、 X が $R^A C(=O)-$ 、 R^A が $R^{2\ 0}$ で置換された $C_4 - C_{15}$ 直鎖アルキルであり、 $R^{2\ 0}$ が $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、 $-C(=O)O-R^{2\ 0\ a}$ 、 $-NHSS(=O)_2R^{2\ 0\ a}$ 、 $-NHC(=O)R^{2\ 0\ a}$ 、 $-NHR^{2\ 0\ b}$ 、またはフタルイミドの時に、 $R^{2\ 2}$ は $-(CH_2)_aCH_2NHC(=NR^4)NH-Y$ ではなく、 Y は H 、 $-CN$ 、または NO_2 である。

【請求項 59】

請求項 58 記載の化合物において、 R^1 は 2-プロピルである。

【請求項 60】

請求項 58 記載の化合物において、 Q は $-B(OH)_2$ である。

【請求項 61】

請求項 58 記載の化合物において、 Q はピナンジオールボロン酸である。

【請求項 62】

請求項 58 記載の化合物において、 X は $R^A C(=O)-$ である。

【請求項 63】

請求項 58 記載の化合物において、 R^2 は $-CH_2NH-C(=O)OCH_2(C_6H_5)$ である。

【請求項 64】

請求項 58 記載の化合物において、 X は $R^A C(=O)-$ であり、 R^A は $C_4 - C_{16}$ アルキルである。

【請求項 65】

請求項 58 記載の化合物において、 X は $R^A C(=O)-$ であり、 R^A は 選択的に 1 ～ 3 個の $R^{2\ 1}$ で置換されたアリールである。

【請求項 66】

請求項 58 記載の化合物において、 X は $R^A C(=O)-$ であり、 R^A は 選択的に 1 ～ 3 個の $R^{2\ 1}$ で置換されたヘテロカルボシクリル基である。

【請求項 67】

請求項 58 記載の化合物、または薬学的に許容可能なその塩、その立体異性体、またはその互変異性体において、

R^1 は 2-プロピルであり、

Q は $-B(OH)_2$ またはピナングジオールボロン酸エステルであり、

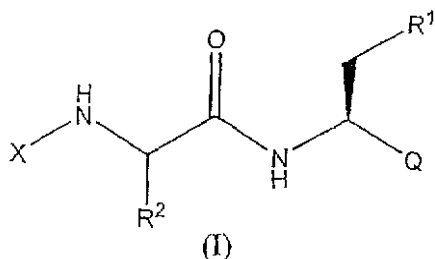
X は $R^A C(=O)-$ であり、

R^A は C_4-C_{16} アルキル、1 ～ 3 個の $R^{2,1}$ で選択的に置換されたアリール、または選択的に 1 ～ 3 個の $R^{2,1}$ で置換されたヘテロカルボシクリル基である。

【請求項 68】

化学式 (I) の化合物、

【化 5】



または薬学的に許容可能なその塩、その立体異性体、またはその互変異性体において、

R^1 は C_1-C_8 アルキル、 C_2-C_8 アルケニル、 C_2-C_8 アルキニル、または C_3-C_7 シクロアルキルであり、

R^2 は $-CH_2NH_2$ または $-CH_2NR^9R^{1,0}$ であり、

R^9 は H または C_1-C_{10} アルキルであり、

$R^{1,0}$ は H、 C_1-C_{10} アルキル、カルボシクリル、ヘテロカルボシクリル、 C_1-C_{10} アルキル- $C(=O)-$ 、カルボシクリル- $C(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリル- $C(=O)-$ 、カルボシクリルアルキル- $C(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリルアルキル- $C(=O)-$ 、 C_1-C_{10} アルキル- $S(=O)_2-$ 、カルボシクリル- $S(=O)_2-$ 、ヘテロカルボシクリル- $S(=O)_2-$ 、カルボシクリルアルキル- $S(=O)_2-$ 、ヘテロカルボシクリルアルキル- $S(=O)_2-$ 、 C_1-C_{10} アルキル- $NHC(=O)-$ 、カルボシクリル- $NHC(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリル- $NHC(=O)-$ 、カルボシクリルアルキル- $NHC(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリルアルキル- $NHC(=O)-$ 、 C_1-C_{10} アルキル- $OC(=O)-$ 、カルボシクリル- $OC(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリル- $OC(=O)-$ 、カルボシクリルアルキル- $OC(=O)-$ 、ヘテロカルボシクリルアルキル- $OC(=O)-$ 、またはアミノ保護基であり、

$R^{1,0}$ は選択的に 1、2、または 3 個の $R^{2,3}$ で置換され、

或いは、 R^9 および $R^{1,0}$ は N 原子と共にヘテロカルボシクリル基を形成し、

Q は $-B(OH)_2$ 、 $-B(OR^{1,4})_2$ 、またはサイクリックボロン酸エステルであり、前記サイクリックボロン酸エステルには 2 ～ 20 個の炭素原子と、選択的に N、S、または O の可能性があるヘテロ原子を含み、

$R^{1,4}$ は H、 C_1-C_4 アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、またはアラールであり、

X は $R^A C(=O)-$ 、 $R^A NHC(=O)-$ 、 $R^A S(=O)_2-$ 、 $R^A OC(=O)-$ 、 $R^A SC(=O)-$ 、または R^A であり、

R^A は選択的に $R^{2,0}$ で置換された C_1-C_{20} アルキル、選択的に $R^{2,0}$ で置換された C_2-C_{20} アルケニル、選択的に $R^{2,0}$ で置換された C_2-C_{20} アルキニル、1 ～ 5 個の $R^{2,1}$ で選択的に置換されたカルボシクリル、または 1 ～ 5 個の $R^{2,1}$ で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルであり、

$R^{2,0}$ は、 $-CN$ 、ハロ、ハロアルキル、 C_1-C_4 アルキル、 C_2-C_4 アルケニ

ル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $-CO_2H$ 、 $-C(=O)CO_2H$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)H$ 、 $-S(=O)NH_2$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH$ (アルキル)、 $-N$ (アルキル) $_2$ 、 $-NHC(=O)NH_2$ 、 $-NHC(=O)R^{20a}$ 、 $-NHC(=O)OR^{20a}$ 、 $-OR^{20a}$ 、 $-SR^{20a}$ 、 $-S(=O)R^{20a}$ 、 $-S(=O)_2R^{20a}$ 、 $-S(=O)_2-NHR^{20a}$ 、 $-SC(=O)R^{20a}$ 、 $-C(=O)R^{20a}$ 、 $-C(=O)NHR^{20a}$ 、 $-C(=O)O-R^{20a}$ 、 $-NHS(=O)_2R^{20a}$ 、 $-NHR^{20b}$ 、フタルイミド、 $-(O-アルキル)_r$ 、 $-O-アルキル-OH$ 、 $-(O-アルキル)_r-OH$ 、 $-OR^{20c}$ 、 $-SR^{20c}$ 、 $-O-アルキル-R^{20c}$ 、 $-S-アルキル-R^{20c}$ 、 $-S(=O)-R^{20c}$ 、 $-S(=O)_2-R^{20c}$ 、 $-S(=O)_2-NHR^{20c}$ 、 $-SC(=O)R^{20c}$ 、 $-C(=O)R^{20c}$ 、 $-C(=O)OR^{20c}$ 、 $-C(=O)NHR^{20c}$ 、1 ～ 5 個の R^{21} で選択的に置換されたカルボシクリル、および 1 ～ 5 個の R^{21} で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルであり、

R^{20a} は、 $C_1 - C_{20}$ アルキル、 $C_2 - C_{20}$ アルケニル、または $C_2 - C_{20}$ アルキニルであり、前記アルキル、アルケニル、またはアルキニルは選択的に 1 若しくはそれ以上のハロ、 $C_1 - C_4$ アルキル、アリール、ヘテロアリールまたは $-NHR^{20b}$ で置換され、

R^{20b} はアミノ保護基であり、

R^{20c} は 1 ～ 5 個の R^{21} で選択的に置換されたカルボシクリル、または 1 ～ 5 個の R^{22} で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルであり、

R^{21} は、 $C_1 - C_{20}$ アルキル、 $C_2 - C_{20}$ アルケニル、 $C_2 - C_{20}$ アルキニル、 $C_1 - C_{20}$ アルコキシ、 $C_1 - C_{20}$ チアルコキシ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、ハロ、ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH$ (アルキル)、 $-N$ (アルキル) $_2$ 、 $-NHC(=O)O-アルキル$ 、 $-NHC(=O)アルキル$ 、 $-C(=O)O-アルキル$ 、 $-C(=O)アルキル$ 、 $-S(=O)-アルキル$ 、 $-S(=O)_2-アルキル$ 、 $-S(=O)-アリール$ 、 $-S(=O)_2-アリール$ 、1 ～ 5 ～ R^{22} で選択的に置換されたカルボシクリル、および 1 ～ 5 個の R^{22} で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され、

R^{22} は、 $C_1 - C_{10}$ アルキル、 $C_2 - C_{10}$ アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ アルキニル、フェニル、ハロ、ハロアルキル、アルコキシ、チアルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、カルボキシル、アルキル- $OC(=O)-$ 、アルキル- $C(=O)-$ 、アリール- $OC(=O)-$ 、アルキル- $OC(=O)NH-$ 、アリール- $OC(=O)NH-$ 、アルキル- $C(=O)NH-$ 、アルキル- $C(=O)O-$ 、 $(アルキル-O)_r-アルキル$ 、 $HO-(アルキル-O)_r-アルキル$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-N_3$ 、 $-CNO$ 、 $-CNS$ 、アルキル- $S(=O)-$ 、アルキル- $S(=O)_2-$ 、 $H_2NS(=O)-$ 、または $H_2NS(=O)_2-$ から成る群から選択され、

R^{23} は、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{23a}$ 、 $-N(R^{23a})_2$ 、 $-N_3$ 、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $-CNO$ 、 $-CNS$ 、 $-C(=O)OR^{23a}$ 、 $-C(=O)R^{23a}$ 、 $-OC(=O)R^{23a}$ 、 $-N(R^{23a})C(=O)R^{23a}$ 、 $-C(=O)N(R^{23a})_2$ 、ウレイド、 $-OR^{23a}$ 、 $-SR^{23a}$ 、 $-S(=O)_2-(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-S(=O)_2-アリール$ 、および $-S(=O)_2-N(R^{23a})_2$ から成る群から選択され、

R^{23a} は H または $C_1 - C_{10}$ アルキルであり、

或いは、2 つの R^{23a} は前記 N 原子と共に結合して 5 ～ 7 員環の複素環基を形成してもよく、

r は 2、3、4、または 5 である。

【請求項 69】

請求項 68 記載の化合物において、 R^1 は 2-プロピルである。

【請求項 70】

請求項 68 記載の化合物において、 Q は $-B(OH)_2$ である。

【請求項 7 1】

請求項 6 8 記載の化合物において、Q はピナジオールボロン酸である。

【請求項 7 2】

請求項 6 8 記載の化合物において、X は $R^A C(=O)-$ である。

【請求項 7 3】

請求項 6 8 の化合物において、 R^2 は $-CH_2NH-C(=O)OCH_2(C_6H_5)$ である。

【請求項 7 4】

請求項 6 8 記載の化合物において、X は $R^A C(=O)-$ であり、 R^A は C_4-C_{16} アルキルである。

【請求項 7 5】

請求項 6 8 記載の化合物において、X は $R^A C(=O)-$ であり、 R^A は選択的に 1-3 $R^{2,1}$ で置換されたアリールである。

【請求項 7 6】

請求項 6 8 記載の化合物において、X は $R^A C(=O)-$ であり、 R^A は選択的に 1-3 $R^{2,1}$ で置換されたヘテロカルボシクリル基である。

【請求項 7 7】

請求項 6 8 記載の化合物、またはその医薬品として認められた塩、立体異性体、または互変異性体において、

R^1 は 2-プロピルであり、

Q はピナジオールボロン酸エステルであり、

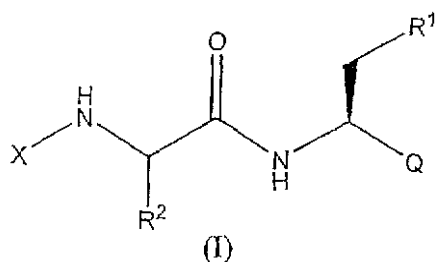
X は $R^A C(=O)-$ であり、

R^A は C_4-C_{16} アルキル、1-3 個の $R^{2,1}$ で選択的に置換されたアリール、または選択的に 1-3 $R^{2,1}$ で置換されたヘテロカルボシクリル基である。

【請求項 7 8】

式 (I) の化合物、

【化 6】



または薬学的に許容可能なその塩、立体異性体、または互変異性体において、

R^1 は C_1-C_8 アルキル、 C_2-C_8 アルケニル、 C_2-C_8 アルキニル、または C_3-C_7 シクロアルキルであり、

R^2 は H であり、

Q は $-B(OH)_2$ 、 $-B(OR^{1,4})_2$ 、またはサイクリックボロン酸エステルであり、前記サイクリックボロン酸エステルには 2-20 個の炭素原子と、選択的に N、S、または O の可能性があるヘテロ原子を含み、

$R^{1,4}$ は H、 C_1-C_4 アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、またはアラルキルであり、

X は $R^A C(=O)-$ 、 $R^A NH C(=O)-$ 、 $R^A S(=O)_2-$ 、 $R^A OC(=O)-$ 、 $R^A SC(=O)-$ 、または R^A であり、

R^A は選択的に $R^{2,0}$ で置換された C_1-C_{20} アルキル、選択的に $R^{2,0}$ で置換された C_2-C_{20} アルケニル、選択的に $R^{2,0}$ で置換された C_2-C_{20} アルキニル、1-5 個の $R^{2,2}$ で選択的に置換されたカルボシクリル、または 1-5 個の $R^{2,2}$ で選択的に

置換されたヘテロカルボシクリルであり、

R^{20a} は、 $-OR^{20a}$ 、 $-SR^{20a}$ 、 $-S(=O)R^{20a}$ 、 $-S(=O)_2R^{20a}$ 、 $-S(=O)_2-NHR^{20a}$ 、 $-SC(=O)R^{20a}$ 、 $-C(=O)R^{20a}$ 、 $-C(=O)NHR^{20a}$ 、 $-C(=O)O-R^{20a}$ 、フタルイミド、 $-(O-アルキル)_r$ 、 $-O-アルキル-OH$ 、 $-(O-アルキル)_r-OH$ 、 $-OR^{20c}$ 、 $-SR^{20c}$ 、 $-O-アルキル-R^{20c}$ 、 $-S-アルキル-R^{20c}$ 、 $-S(=O)-R^{20c}$ 、 $-S(=O)_2-R^{20c}$ 、 $-S(=O)_2-NHR^{20c}$ 、 $-SC(=O)R^{20c}$ 、 $-C(=O)R^{20c}$ 、 $-C(=O)OR^{20c}$ 、 $-C(=O)NHR^{20c}$ 、1 ～ 5 個の R^{22} で選択的に置換されたカルボシクリル、および 1 - 5 R^{22} で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され、

R^{20a} は、 C_1-C_{20} アルキル、 C_2-C_{20} アルケニル、または C_2-C_{20} アルキニルであり、

前記アルキル、アルケニル、またはアルキニルは選択的に 1 若しくはそれ以上のハロ、 C_1-C_4 アルキル、アリール、ヘテロアリールまたは $-NHR^{20b}$ で置換され、

R^{20c} は 1 ～ 5 個の R^{21} で選択的に置換されたカルボシクリル、または 1 ～ 5 個の R^{22} で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルであり、

R^{22} は、 C_1-C_{10} アルキル、 C_2-C_{10} アルケニル、 C_2-C_{10} アルキニル、フェニル、ハロ、ハロアルキル、アルコキシ、チアルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、カルボキシル、アルキル- $OC(=O)-$ 、アルキル- $C(=O)-$ 、アリール- $OC(=O)-$ 、アルキル- $OC(=O)NH-$ 、アリール- $OC(=O)NH-$ 、アルキル- $C(=O)NH-$ 、アルキル- $C(=O)O-$ 、 $(アルキル-O)_r$ -アルキル、 $HO-(アルキル-O)_r$ -アルキル、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-CN$ 、 $-N_3$ 、 $-CNO$ 、 $-CNS$ 、アルキル- $S(=O)-$ 、アルキル- $S(=O)_2-$ 、 $H_2NS(=O)-$ 、または $H_2NS(=O)_2-$ から成る群から選択され、

r は 2、3、4、5、6、7、8、9、または 10 である。

【請求項 79】

請求項 78 記載の化合物において、

X は $R^A C(=O)-$ 、 $R^A NHC(=O)-$ 、 $R^A S(O)_2-$ 、または R^A であり

R^A は R^{20} で選択的に置換された C_1-C_{14} アルキルであり、

R^{20} は $-O-アルキル$ 、 $-(O-アルキル)_r$ 、 $-O-アルキル-OH$ 、または $-(O-アルキル)_r-OH$ であり、

r は 2、3、4、または 5 である。

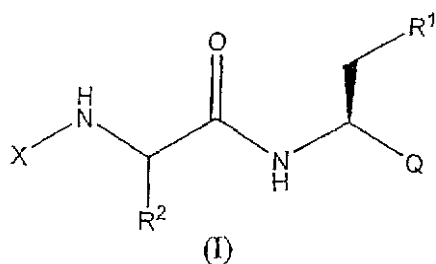
【請求項 80】

請求項 78 記載の化合物において、前記 $O-アルキル$ はメトキシ、エトキシ、またはプロポキシである。

【請求項 81】

式 (I) の化合物、

【化 7】



または薬学的に許容可能なその塩、立体異性体、または互変異性体において、

R^1 は 2-プロピルであり、

R^2 は $-CH_2CH_2CH_2NHC(=NH)NH-NO_2$ 、 $-CH_2CH_2CH_2NHC(=O)NH_2$ 、 $-CH(CH_3)OH$ 、 $-CH_2CONH_2$ 、 $-CH_2NH_2$ 、または $-CH_2NR^9R^{10}$ であり、

R^2 は H であり、

R^{10} は、メチル- $C(=O)-$ 、エチル- $C(=O)-$ 、プロピル- $C(=O)-$ 、ブチル- $C(=O)-$ 、ペンチル- $C(=O)-$ 、2-(エトキシカルボニル)エチル- $C(=O)-$ 、4-メチルフェニル- $C(=O)-$ 、シクロプロピル- $C(=O)-$ 、4-フルオロフェニル- $C(=O)-$ 、4- H_2NSO_2 -フェニル- $C(=O)-$ 、4- H_3CSO_2 -フェニル- $C(=O)-$ 、4-フェニルフェニル- $C(=O)-$ 、3, 4-ジメトキシベンジル- $C(=O)-$ 、3-ピリジニル- $C(=O)-$ 、2-(ヒドロキシ)-ピリジン-3-イル- $C(=O)-$ 、6-(モルホリノ)-ピリジン-3-イル- $C(=O)-$ 、2-(ピリジン-4-イル)チアゾール-4-イル- $C(=O)-$ 、2-ピラジニル- $C(=O)-$ 、2, 5-ジメチルピラゾリル- $C(=O)-$ 、N-メチル-2-ピロリル- $C(=O)-$ 、2-ピロリジニル- $C(=O)-$ 、2-チオフェニル- $C(=O)-$ 、5-イソキサゾリル- $C(=O)-$ 、4-(テトラゾール-5-イル)フェニル- $C(=O)-$ 、(5-テトラゾリル) $CH_2-C(=O)-$ 、 $N-H_3CSO_2$ -ピペリジニル- $C(=O)-$ 、ブチル- $OC(=O)-$ 、(ベンジル)- $OC(=O)-$ 、(9-フルオレニルメチル)- $OC(=O)-$ 、ペンチル- $NHC(=O)-$ 、プロピル- $NHC(=O)-$ 、フェニル- $NHC(=O)-$ 、4-メチルフェニル- $NHC(=O)-$ 、メチル- $S(=O)_2-$ 、4-フルオロフェニル- $S(=O)_2-$ 、4-シアノフェニル- $S(=O)_2-$ 、1-メチルイミダゾール-4-イル- $S(=O)_2-$ 、2-チオフェニル- $S(=O)_2-$ 、(4-メチルフェニル)- $NHC(=O)NH-S(=O)_2-$ 、(4-メチルフェニル)- $S(=O)_2NHC(=O)-$ であり；

代わりに、 R^9 および R^{10} と、N原子にピロリルまたはピラゾリルから R^9 および R^{10} が結合し、

Q は $-B(OH)_2$ 、ピナンジオールボロン酸エステル、ビスクロヘキシル-1, 1'-ジオールボロン酸エステル、または 1, 2-ジシクロヘキシルエタン-1, 2-ジオールボロン酸エステルであり、

X は、 $R^A C(=O)-$ 、 $R^A NHC(=O)-$ 、 $R^A S(=O)_2-$ 、または $R^A OC(=O)-$ であり、

R^A は、 CH_3- 、 C_2H_5- 、 C_3H_7- 、 C_4H_9- 、 $C_5H_{11}-$ 、 $C_6H_{13}-$ 、 $C_7H_{15}-$ 、 $C_8H_{17}-$ 、 $C_9H_{19}-$ 、 $C_{10}H_{21}-$ 、 $C_{11}H_{23}-$ 、 $C_{12}H_{25}-$ 、 $C_{13}H_{27}-$ 、アダマンチル、ビスクロヘプタニル、 R^{20} で置換された C_{1-3} アルキル、 R^{20} で置換された C_{2-10} アルケニル、0 ～ 3 個の R^{21} で置換されたシクロプロピル、0 ～ 2 個の R^{21} で置換されたシクロペンチル、0 ～ 2 個の R^{21} で置換されたシクロヘキシル、0 ～ 3 個の R^{21} で置換されたフェニル、0 ～ 2 個の R^{21} で置換されたナフチル、0 ～ 3 個の R^{21} で置換されたピラジニル、0 ～ 1 個の R^{21} で置換されたキノリニル、0 ～ 1 個の R^{21} で置換されたイミダゾリル、0 ～ 1 個の R^{21} で置換されたテトラヒドロフラニル、0 ～ 1 個の R^{21} で置換されたオキソチアゾリジニル、0 ～ 1 個の R^{21} で置換されたベンゾチアゾリル、0 ～ 2 個の R^{21} で置換されたチアゾリル、0 ～ 2 個の R^{21} で置換されたフラニル、0 ～ 1 個の R^{21} で置換されたピロリジニル、0 ～ 1 個の R^{21} で置換されたピペリジニル、0 ～ 1 個の R^{21} で置換されたピペラジニル、0 ～ 1 個の R^{21} で置換されたピラジニルであり、

個の R^{20} は、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、ペントキシ、ヘキシロキシ、ヘプチロキシ、オクチロキシ、メトキシエトキシ、メトキシエトキシエトキシ、メチル-S-、エチル-S-、オクチル-S-、メチル- $C(=O)S-$ 、(アセチルアミノ)メチル-S-、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、メチル- $C(=O)-$ 、フェニル- $C(=O)-$ 、(H_3CSO_2)フェニル- $C(=O)-$ 、チオフェニル- $C(=O)-$ 、メチル- $OC(=O)-$ 、エチル-O

C(=O)－、ブチル－OC(=O)NH－、メチル－C(=O)NH－、メトキシエトキシ－メチル－C(=O)NH－、H₂NC(=O)－、メチル－NHC(=O)－、エチル－NHC(=O)－、プロピル－NHC(=O)－、フェニル－NHC(=O)－、H₂NC(=O)NH－、H₂NS(=O)₂－、オクチル－S(=O)₂－、フェニル－S(=O)₂－、メチルフェニル－S(=O)₂－、チオフェニル－S(=O)₂－、シクロペンチル－、シクロヘキシル－、シクロヘプチル－、アダマンチル－、ビスシクロヘプタニル－、シクロペンテニル－、フェニル－、メトキシフェニル－、メチルフェニル－、ジメチルフェニル－、エチルフェニル－、プロピルフェニル－、ブチルフェニル－、フルオロフェニル－、ジフルオロフェニル－、クロロフェニル－、ブロモフェニル－、ヨードフェニル－、ジメチルアミノフェニル－、シクロヘキシロキシ－、2－イソプロピル－5－メチルシクロヘキシロキシ－、ナフチル－、メトキシナフチル－、ナフチロキシ－、フェノキシ－、(メチルフェニル)オキシ－、(エチルフェニル)オキシ－、(プロピルフェニル)オキシ－、(ブチルフェニル)オキシ－、(フルオロフェニル)オキシ－、(クロロフェニル)オキシ－、(ブロモフェニル)オキシ－、ナフチル－S－、ベンジル－S－、(メチルフェニル)メチル－S－、ピリミジニル－S－、ピペリジニル－、N－メチルピペリジニル－、N－プロピルピペリジニル－、フタルイミド－、チオフェニル－、メチルチオフェニル－、イミダゾリル－、フラニル－、テトラゾリル－、オキソピロリジニル－、インドリル－、およびメチルインドリル－から成る群から選択され、

R^{2 1} は、メチル－、エチル－、プロピル－、ブチル－、ペンチル－、ヘキシル－、ヘプチル－、エテニル－、プロベニル－、ブテニル－、メトキシ－、エトキシ－、プロポキシ－、フェノキシ－、フルオロ－、クロロ－、ブロモ－、メチル－C(=O)－、ブチル－OC(=O)－、ブチル－OC(=O)NH－、フェニル－、メトキシフェニル－、フルオロフェニル－、クロロフェニル－、ブロモフェニル－、ピロリル－、ピリジニル－から成る群から選択されるものである。

【請求項 8 2】

以下から選択される化合物、

【表 1 - 1】

実施例番号	化合物名
D.1.1	ナフタレン-2-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.1.2	2-ピラジンカルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.1.3	3-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-プロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.1.4	4-ブチルベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.1.5	3-[(1,1-ジメチルエトキシ)カルボニルアミノ]ベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.1.6	2-(2-メトキシエトキシ)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.1.7	2-[2-(2-メトキシエトキシ)エトキシ]アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.1.8	(E)-3-(エトキシカルボニル)アクリルアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.1.9	2-ピペリジン-1-イル-アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.1.10	4-(1-メチル-ピペリジン-4-イル)-ブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 2】

D.1.11	2-アセチルアミノ-アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.2.1	4-(メトキシカルボニル)ブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.2.2	4-(1-ブチル-ピペリジン-4-イル)-ブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.2.3	2-ブトキシアセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.1	デカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.2	ナフタレン-1-カルボキسامイド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.3	2-フェニルアセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.4	1-フェニルシクロペンタンカルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.5	(2R)-2-フェニルブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.6	(2S)-2-フェニルブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.7	ドデカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 3】

D.3.8	オクタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.9	アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.10	4-(1,1-ジメチルエチル)シクロヘキササンカルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.11	トランス-4-ベンチルシクロヘキササンカルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.12	4-フェニルブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.13	2-(3-メトキシフェニル)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.14	4-(1,1-ジメチルエチル)ベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.15	ノナンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.16	(RS)-2-シクロベンチルヘキササンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.17	チオフエン-2-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.18	2,3-ジフルオロベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 4】

D.3.19	2-(2-イオドフェニル)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル
D.3.20	シクロヘキササンカルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.21	2-(4-ブロモフェニル)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.22	ベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.23	2-メチルベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.24	4-ブロモベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.25	(2S)-2-フェニルプロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.26	(E)-2-メチル-3-フェニル-アクリルアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.27	2-[(ナフタレン-2-イル)オキシ]アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.28	2,2-ジメチルブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.29	2-(2-クロロフェニル)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 5】

D.3.30	5-メチルチオフエン-2-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.31	cis-3-(2-メトキシフェニル)アクリルアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.32	(2-メチルフェノキシ)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.33	2-(2,5-ジメチルフェニル)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.34	トランス-3-(2-ブロモフェニル)アクリルアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.35	4-イソプロピルベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.36	4-(4-メチルフェニル)ブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.37	2-(2-ナフチルスルファニル)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.38	5-メチルヘキサナムド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.39	3-チオフエン-2-イル-プロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 6】

D.3.40	2,4-ジメチルチアゾール-5-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.41	フラン-3-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒド ロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メ チルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.42	(2R)-2-フェニルプロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘ キサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イ ル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ] ブチル]
D.3.43	2-シクロヘプチルアセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキ サヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イ ル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ] ブチル]
D.3.44	1-メチルシクロプロパンカルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘ キサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.45	1-メチルシクロヘキサカルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘ キサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.46	2-[(1S,2R,5S)-2-イソプロピル-5-メチルシクロヘキシル]オキシアセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6- メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボ ニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.47	(E)-2-ブテンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ- 3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチ ルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.48	3-メチルブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ- 3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチ ルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.49	3-フェニルプロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒ ドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3- メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチ ル]
D.3.50	4-(4-メトキシフェニル)-ブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘ キサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 7】

D.3.51	チオフェン-3-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.52	2-チオフェン-3-イル-アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.53	(E)-ペンタ-2,4-ジエン酸アミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.54	2-(4-イソプロピルフェノキシ)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.55	2-(4-エチルフェノキシ)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.56	(E)-2-メチルヘキサ-2-エン酸アミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.57	3-(3-メチルフェニル)アクリルアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.58	2-アダマンタン-1-イルアセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.59	(RS)-2-シクロペンタ-2-エニルアセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.60	4-ジエチルアミノベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 8】

D.3.61	(RS)-2-メチルブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.62	3-(4-メチルフェニル)アクリルアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.63	ヘキサ a-2,4-ジエン酸アミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.64	4-ピロール-1-イル-ベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.65	(E)-3-チオフエン-3-イル-アクリルアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.66	ヘプタ-2-エナミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.67	2-(3,4-ジメチルフェノキシ)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.68	デカ-9-エナミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.69	(E)-ウンデカ-2-エン酸アミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.70	(E)-デカ-3-エン酸アミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 9】

D.3.71	2,2-ジメチル-3-(2-メチルプロペニル)-シクロプロパンカルボキサミド, N- [(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メ タノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニ ル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.72	2-メチルシクロヘキサノカルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1- [(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.73	5-シクロヘキシルペンタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘ キサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イ ル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ] ブチル]
D.3.74	3-メトキシシクロヘキサノカルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1- [(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.75	(3R)-3,7-ジメチル-オクト-6-エン酸アミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1- [(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.76	3-[(4-メチルベンジル)スルファニル]プロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1- [(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.77	(3S)-3,7-ジメチル-オクト-6-エン酸アミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1- [(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.78	(RS)-4-エチルオクタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキ サヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イ ル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ] ブチル]
D.3.79	5-フルオロ-2-メトキシベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)- ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2- イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミ ノ]ブチル]
D.3.80	2-(4-ブロモフェノキシ)-アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1- [(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 1 0】

D.3.81	2-(1-メチル-1H-インドール-3-イル)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.82	ヘキサヒドロ-2,5-メタノペンタレン-3a(1H)-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.83	ビシクロ[2.2.1]ヘプタン-2-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.84	(RS)-2-(4-クロロフェニル)プロピオンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.85	(2S)-2-メチルブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.86	(4RS)-1-[(1,1-ジメチルエトキシ)カルボニル]-ピペリジン-4-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.87	(RS)-4-メチルオクタナアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.88	2-フルオロ-5-メチルベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.89	2-(ビシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.90	シクロプロパンカルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 1 1】

D.3.91	4-エトキシベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.92	(E)-3-(4-プロモフェニル)アクリルアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.93	(2S)-2-(6-メトキシナフタレン-2-イル)-プロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.94	3-フルオロ-4-メトキシベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.95	4-フルオロ-3-メチルベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.96	ノン-2-エン酸アミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.97	(E)-3-(ナフタレン-2-イル)アクリルアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.98	キノリン-2-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.99	1-(4-メトキシフェニル)-シクロプロパンカルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.101	3-ブテンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.102	テトラデカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 1 2】

D.3.103	3-(1H-インドール-3-イル)-プロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.104	4-フェノキシブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.105	5-オキソ-5-フェニル-ペンタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.106	(2R)-1-((1,1-ジメチルエトキシ)カルボニル)-ピペリジン-2-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.107	ピリジン-2-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.108	ピリジン-3-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.109	ピリジン-4-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.110	(2S)-1-((1,1-ジメチルエトキシ)カルボニル)-ピペリジン-2-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.111	(2R)-1-((1,1-ジメチルエトキシ)カルボニル)-ピペリジン-2-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.112	3,3-ジメチル-ブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 1 3】

D.3.113	4-[(フェニルアミノ)カルボニル]ブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.114	2,2-ジメチルペンタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.115	5-チオフェン-2-イル-ペンタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.116	(3RS)-1-[(1,1-ジメチルエトキシ)カルボニル]-ピペリジン-3-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.117	8-フェニル-オクタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.118	3-[(1,1-ジメチルエトキシ)カルボニル]アミノ]プロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.119	Tri デカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.120	スクシンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.121	ペンタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.122	[[[(9H-フルオレン-9-イル)メトキシ]カルボニル]アミノ]ブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.123	2-(ジメチルアミノ)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 1 4】

D.3.124	5-(4-フルオロフェニル)-ペンタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.125	8-オキソ-8-フェニルオクタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)- ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2- イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミ ノ]ブチル]
D.3.126	4-(チオフエン-2-イル)ブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)- ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2- イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミ ノ]ブチル]
D.3.127	5-オキソ-5-(チオフエン-2-イル)ペンタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1- [(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.128	2-(3-クロロフェニル)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘ キサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ] ブチル]
D.3.129	ウンデカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ- 3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチ ルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.130	4-ヘプチルベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒド ロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メ チルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.131	6-フェニルヘキサノアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒ ドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3- メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチ ル]
D.3.132	5-フェニルペンタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒ ドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3- メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチ ル]
D.3.133	10-ヒドロキシデカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒ ドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3- メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチ ル]

【表 1 - 1 5】

D.3.134	5-オキソ-5-(4-フェニルピペラジン-1-イル)ペンタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.135	2-(1H-テトラゾール-5-イル)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.136	2-(テトラゾール-1-イル)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.137	2-(ヒリミジン-2-イルスルファニル)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.138	3-メチルスルファニルプロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.139	3-(ナフタレン-2-イルスルファニル)プロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.140	2-[(フェニルメチル)スルファニル]アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.141	6-オキソヘプタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.142	4-(4-メタンスルフォニルフェニル)-4-オキソブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.143	(2S)-1-アセチルピロリジン-2-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 1 6】

D.3.144	3-ヒドロキシ-2,2-ジメチルプロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.145	2-エチルスルファニルアセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.146	3-ウレイドプロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.147	3-メトキシプロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.148	2-メチルスルファニルアセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.149	3H-イミダゾール e-4-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.150	7-オキソ-オクタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.151	(E)-3-(イミダゾール-4-イル)アクリルアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.152	(RS)-テトラヒドロフラン-3-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.153	(E)-3-(2-メトキシフェニル)アクリルアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.154	2-エトキシアセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 17】

D.3.155	-フラン-2-イル-プロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.156	-(ベンゼンスルフォニル)プロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.157	-スルファモイルブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.158	(4S)-2-オキソ-1,3-チアゾリジン-4-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.159	(2R)-1-アセチルピロリジン-2-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.160	-(アセチルアミノ)メチルスルファニル]-プロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.161	-(アセチルスルファニル)ヘキサナアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.162	(チオフエン-2-スルフォニル)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.163	-(アセチルアミノ)ブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.164	(2Z)-3-(プロピルアミノカルボニル)-2-プロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 18】

D.3.165	-(オクチルスルファニル)プロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.166	-(オクチルスルファニル)プロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.167	,2-ジメチルヘキサナアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサ ヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]- 3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブ チル]
D.3.168	-ヒドロキシヘキサナアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒ ドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3- メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチ ル]
D.3.169	-オキソペンタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒド ロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メ チルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.170	-オキソヘキサナアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒド ロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メ チルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.171	ベンゾチアゾール-6-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.172	-(オクチルオキシ)プロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘ キサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2- イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミ ノ]ブチル]
D.3.173	-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロ アミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.174	ベンズアミド, N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ- 3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチ ルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.3.175	-(2-(2-メトキシエトキシ)エトキシ)アセトアミド, N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジ オキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロ ピル]

【表 1 - 19】

D.3.176	-フェニルブタンアミド, N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.3.177	(4-メチルフェノキシ)アセトアミド, N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.3.178	ヘキサナムド, N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.3.179	-ブチルベンズアミド, N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.3.180	ナフタレン-2-カルボキサミド, N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.3.181	ヘキサナムド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.182	-(4-メチルベンゼンスルフォニル)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.183	ヘブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.184	1-(カルバモイル)ウンデカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.185	-(ベンゼンスルフォニル)アセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.4.1	ナフタレン-1-スルホンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 1 - 20】

D.4.2	ナフタレン-2-スルホンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.4.3	デカン-1-スルホンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.4.4	オクタンスルホンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.4.5	ベンゼンスルホンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.5.1	(2S)-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-ナフチルメチル)-アミノ]-ペンタンアミド, N-[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]
D.5.2	(2S)-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(1-ナフチルメチル)-アミノ]-ペンタンアミド, N-[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]
D.5.3	(2S)-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[ウンデシルアミノ]-ペンタンアミド, N-[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]
D.5.4	(2S)-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(フェニルメチル)アミノ]-ペンタンアミド, N-[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]
D.6.1	N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]-N'-(2-ナフチル)ウレア
D.6.2	N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]-N'-フェニルウレア
D.6.3	N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]-N'-ヘプチルウレア
D.6.4	N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]-N'-(1-ナフチル)ウレア
D.6.5	N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]-N'-ウンデシルウレア

【表 1 - 2 1】

D.6.6	N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]-N'-ウンデシルウレア
D.6.7	N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]-N'-[5-(エトキシカルボニル)ペンチル]ウレア
D.7.1	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2E)-3-(2-メトキシフェニル)-1-オキソプロップ-2-エニル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.2	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(E)-2-メチル-3-フェニルアクリル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.3	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(4-(4-メチルフェニル)ブタノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.4	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2RS)-2-フェニルプロパノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.5	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-(4-イソプロピルフェノキシ)アセチル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.6	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(5-オキソ-5-フェニルペンタノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.7	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(4RS)-1-[(1,1-ジメチルエトキシ)カルボニル]ピペリジン-4-カルボニル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.8	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(4-ジエチルアミノベンゾイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.9	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(E)-2-メチルヘキサ-2-エノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.10	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(チオフェン-3-カルボニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.11	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(4-イソプロピルベンゾイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.12	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(5-メチルチオフェン-2-カルボニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.13	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(ベンゾイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.14	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(E)-2-ブテノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]

【表 1 - 2 2】

D.7.15	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(E)-ペンタ-2,4-di エノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.16	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(3,3-ジメチル-ブタノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.17	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[5-(2,5-ジメチルフェノキシ)-2,2-ジメチルペンタノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.18	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2,2-ジメチルペンタノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.19	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[4-(チオフェン-2-イル)ブタノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.20	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[5-(4-フルオロフェニル)ペンタノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.21	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2,2-ジメチルヘキサノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.22	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(ヘキサ-2,4-エノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.23	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[3-(チオフェン-2-イル)プロパノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.24	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(5-シクロヘキシルペンタノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.25	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[[(3R)-3,7-ジメチルオクト-6-エノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.26	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[3-[(4-メチルベンジル)スルファニル]プロパノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.27	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(4-ピロール-1-イルベンゾイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.28	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(5-フルオロ-2-メトキシベンゾイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.29	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[[(2S)-2-メチルブタノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.30	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(シクロプロパンカルボニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.31	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(4-エトキシベンゾイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]

【表 1 - 2 3】

D.7.32	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(E)-3-(4- ブロモフェニル)プロップ-2-エノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メ チルブチル]
D.7.33	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2S)-2- (6-メトキシナフタレン-2-イル)-プロパノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミ ノ]-3-メチルブチル]
D.7.34	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[1-(4-メ トキシフェニル)-シクロプロパンカルボニル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]- 3-メチルブチル]
D.7.35	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(3-フルオ ロ-4-メトキシベンゾイル]アミノ)-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.36	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(E)-3-(ナ フタレン-2-イル)プロップ-2-エノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メ チルブチル]
D.7.37	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(4-フルオ ロ-3-メチルベンジル]アミノ)-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.38	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[[9H-フ ルオレン-9-イル]メトキシ]カルボニル]アミノ]ブタノイル]アミノ]-1-オキソペ ンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.39	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(4-ブロモ ベンゾイル]アミノ)-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.40	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(3-ブテノ イル]アミノ)-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.41	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(ウンデカ ノイル]アミノ)-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.42	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[4-(アセチ ルアミノ)ブタノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.43	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(6-フェニ ルヘキサノイル]アミノ)-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]-
D.7.44	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(5-フェニ ルペンタノイル]アミノ)-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]-
D.7.45	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(3-メトキシ プロパノイル]アミノ)-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]-
D.7.46	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[2,2-ジメ チル-3-(2-メチルプロペニル)-シクロプロパンカルボニル]アミノ]-1-オキソ ペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]-
D.7.47	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(3-メトキシ シクロヘキサノイル]アミノ)-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチ ル]-

【表 1 - 2 4】

D.7.48	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[3-(1H-インドール-3-イル)-プロパノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]-
D.7.49	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[[(RS)-2-シクロペンタ-2-エニル-アセチル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.50	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(5-チオフェン-2-イル-ペンタノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.51	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(6-オキソヘプタノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.52	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(7-オキソオクタノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.53	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(ヘキサノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.54	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(ヘプタノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.55	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(3-オクチルオキシ-プロパノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.56	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(ベンゾチアゾール-6-カルボニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.57	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(ウンデカ-2-エノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.58	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(9-デカエノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.7.59	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(テトラデカノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
D.8	デカンアミド, N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]-
D.8.1	(2S)-2-[(ベンジルオキシカルボニル)アミノ]-4-メチルペンタンアミド, N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]-
D.8.2	10-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-デカン-アミド-N-[(1S),(2R)-2-ヒドロキシ, 1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-プロピル]-
D.9	デカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(4-メチルベンゾイル)アミノ]エチル]-

【表 1 - 2 5】

D.10	2-S-デカノイルアミノ-3-(ヘキサノイルアミノ)-プロピオンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]
D.11	2-S-デカノイルアミノ-3-(4-フルオロスルフォニルアミノ)プロピオンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]
D.12	2-S-デカノイルアミノ-3-(3,4-ジメトキシフェニルアセトアミド)プロピオンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]
D.13	2-S-デカノイルアミノ-3-(フェニルウレイド)プロピオンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]
D.14	2-アミノアセトアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル], 塩酸塩
D.15	3-アミノプロパンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル], 塩酸塩
D.15.1	(4RS)-ピペリジン-4-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル], HCl 塩
D.15.2	(RS)-ピペリジン-2-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル], HCl 塩
D.15.3	(2S)-ピペリジン-2-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル], HCl 塩
D.15.4	(2R)-ピペリジン-2-カルボキサミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル], HCl 塩
D.16.1	デカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(アセトアミド)エチル]-

【表 1 - 2 6】

D.16.2	デカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(9-フルオレニルメチルオキシカルバモイル)エチル]-
D.16.3	デカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(ペンチル-ウレイド)エチル]-
D.16.4	デカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(メタンスルホンアミド)エチル]-
D.16.5	デカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(エトキシカルボニル-スクシニル)-アミド]エチル]-
E.1.1	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2E)-3-エトキシカルボニル-1-オキソプロップ-2-エニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.2	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-ピラジンカルボニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.3	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(4-ブチルベンゾイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.4	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-ナフトイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.5	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(3-(1,3-ジヒドロ-1,3-ジオキソ-2H-イソインドール-2-イル)-1-オキソプロピルアミノ)-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.6	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[2-(2-メトキシエトキシ)アセチル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル], HCl 塩
E.1.7	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-ブトキシアセチル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.8	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[2-[2-(2-メトキシエトキシ)エトキシ]アセチル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.9	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[2-(アセチルアミノ)アセチル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル], HCl 塩
E.1.10	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[4-(メトキシカルボニル)ブタノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.11	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-(ナフタレン-2-イルオキシ)アセチル]アミノ)-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]

【表 1 - 27】

E.1.12	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(3-チオフェン-2-イル-プロパノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.13	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[2-(2-クロロフェニル)アセチル]アミノ]-3-メチルブチル]HCl 塩
E.1.14	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(1-オキソ-4-(1-ブチルピペリジン-4-イル)ブチル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.15	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(1-オクタンスルフォニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル], HCl 塩
E.1.16	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-3-[(4-メチルベンゾイル)アミノ]-2-[(デカノイルアミノ)]-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.17	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(デカノイル)アミノ]-1-オキソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.18	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[[10-(1,3-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-デカノイル]アミノ]-1-オキソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.1	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(1-オキシデシル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.2	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(オクタノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.3	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(1-フェニルシクロペンタンカルボニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.4	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2R)-2-フェニルブタノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.5	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[4-(1,1-ジメチルエチル)シクロヘキサンカルボニル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.6	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(トランス-4-ペンチルシクロヘキサンカルボニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.7	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(4-フェニルブタノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.8	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(4-(1,1-ジメチルエチル)ベンゾイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.9	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(ノナノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.10	ボロン酸, [(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-チオフェンカルボニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]

【表 1 - 2 8】

E.2.11	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2,3-ジフルオロベンゾイル)アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.12	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(do デカノイル)アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.13	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-(2-イオドフェニル)アセチル)アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.14	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(シクロヘキサノール)カルボニル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.15	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-メチルベンゾイル)アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.16	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2S)-2-フェニルプロパノイル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.17	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2,2-ジメチルブタノイル)アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.18	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(キノリン-2-カルボニル)アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.19	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(ノン-2-エノイル)アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.20	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-メチルシクロヘキサノール)カルボニル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.21	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(ヘプタ-2-エノイル)アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.22	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-(3,4-ジメチルフェノキシ)アセチル)アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.23	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(RS)-4-エチルオクタノイル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.24	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(ヘキサヒドロ-2,5-メタノペンタレン-3a(1H)-カルボニル)アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.25	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(ピシクロ[2.2.1]ヘプタン-2-カルボニル)アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.26	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(5-メチルヘキサノイル)アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.27	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2,4-ジメチルチアゾール-5-カルボニル)アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.28	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(フラン-3-カルボニル)アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]

【表 1 - 2 9】

E.2.29	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-シクロヘプチルアセチル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.30	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(1-メチルシクロプロパンカルボニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.31	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(3-メチルブタノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.32	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(3-フェニルプロパノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.33	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(E)-3-(3-メチルフェニル)アクリル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.34	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-アダマント-1-イルアセチル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.35	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(RS)-2-メチルブタノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.36	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-フェニルアセチル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.37	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-(4-メトキシフェニル)アセチル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.38	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-(4-ブロモフェニル)アセチル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.39	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(RS)-4-メチルオクタノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.40	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-フルオロ-5-メチルベンゾイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.41	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-(ピシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イル)アセチル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.42	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(4-フェノキシブタノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.43	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-ピリジンカルボニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.44	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(3-ピリジンカルボニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.45	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(tri デカノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.46	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(8-フェニルオクタノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]

【表 1 - 3 0】

E.2.47	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[4-(4-メタンスルフォニルフェニル)-4-オキシブタノイル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.48	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[3-(ナフタレン-2-イルスルファニル)-プロパノイル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.49	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[2-[(フェニルメチル)スルファニル]アセチル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.50	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[3-メチルスルファニルプロパノイル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.51	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[[(2S)-1-アセチルピロリジン-2-カルボニル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.52	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[トランス-3-(2-ブロモフェニル)アクリル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.53	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[2-(テトラゾール-1-イル)アセチル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.54	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[2-(ピリミジン-2-イルスルファニル)アセチル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.55	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[2-(4-エチルフェノキシ)アセチル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.56	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[2-(2,5-ジメチルフェニル)アセチル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.57	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[8-オキソ-8-フェニルオクタノイル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.58	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[2-(2-ナフチルスルファニル)アセチル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.59	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[[(RS)-2-シクロペンチルヘキサノイル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.60	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[3-(4-メチルフェニル)アクリル]アミノ]-1-オキシペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]

【表 1 - 3 1】

E.2.61	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[4-(4-メトキシフェニル)-ブタノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.62	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-チオフエン-3-イル)-アセチル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.63	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[2-(ジメチルアミノ)アセチル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.64	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[5-オキソ-5-(チオフエン-3-イル)ペンタノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.65	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(アセチル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.66	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-エチルスルファニル)アセチル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.67	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(10-ヒドロキシデカノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.68	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(2-メチルスルファニル)アセチル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.69	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[チオフエン-2-スルフォニル)アセチル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.70	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[3-(ベンゼンスルフォニル)プロパノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.71	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[[(RS)-テトラヒドロフラン-3-カルボニル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.72	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(ナフタレン-1-スルフォニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]-
E.2.73	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(ナフタレン-2-スルフォニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]-
E.2.74	ボロン酸, [(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(ベンゼンスルフォニル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]-
F.1	デカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(4R,5R)-4,5-di シクロヘキシル-[1,3,2] ジオキサボロラン-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]-
F.2	4-フェニルブタンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[13,15-ジオキサ-14-ボラジスピロ[5.0.5.3]-ペンタデカ-14-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]-

または薬学的に許容可能なその塩、またはその遊離塩基。

【請求項 8 3】

以下から選択された化合物、

【表 2 - 1】

実施例 番号	化合物名
D.2.6	2-[2-(2-メトキシエトキシ)アセチルアミノ]アセトアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル)
D.2.7	デカンアミド、N-[1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]メチル]
D.2.8	2-[2-(2-メトキシエトキシ)エトキシ]アセトアミド (N-[1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]メチル]
D.2.9	デカンアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-5-ウレイドペンチル]-
D.2.10	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-5-ウレイドペンチル]-
D.3.190	3-[4-(2-プロピル)フェニル]プロパンアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.191	3-[4-(エチル)フェニル]プロパンアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.3.192	6-ヒドロキシヘキサザンアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.4.6	4-ブトキシエンゼンスルホンアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.4.7	4-ブチルベンゼンスルホンアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]

【表 2 - 2】

D.4.8	4-ペンチルトベンゼンスルホンアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]
D.6.8	N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]-N'-(4-ブチルフェニル)ウレア
D.6.9	N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-4-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]ブチル]-N'-(4-ヘプチルオキシフェニル)ウレア
D.8.3	4-(ピリジン-3-イル)ベンズアミド、N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.8.4	2-ピラジンカルボキサミド、N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.8.5	トリデカンアミド (N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.8.6	4-フェニルベンズアミド、N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.8.7	2,2-ジメチルデカンアミド、N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.8.8	(4-フェノキシ)ベンズアミド、N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.8.9	5-ブチル-2-ピリジンカルボキサミド、N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]

【表 2 - 3】

D.8.10	4-プロボキシベンズアミド、N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.8.11	3-(3-ピリジル)ベンズアミド (N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.8.12	6-フェニル-2-ピリジンカルボキサミド (N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.8.13	3-プロボキシベンズアミド (N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.8.14	1-プロモナフタレン-2-カルボキサミド (N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.8.15	6-プロモナフタレン-2-カルボキサミド (N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.8.16	3-フェニルベンズアミド (N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.8.17	4-(2-フルオロフェニル)ベンズアミド (N-[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]
D.8.18	2-ピラジンカルボキサミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-カルボモイルエチル]
D.8.19	デカンアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-カルボモイルエチル]
D.8.20	4-ブチルベンズアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-カルボモイルエチル]
D.16.6	4-ブチルベンズアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(ベンジロキシカルボニルアミド)エチル]-

【表 2 - 4】

D.16.7	4-ブチルベンズアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(1H-ピラゾール)エチル]-
D.16.8	デカンアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(ベンジロキシカルボニルアミド)エチル]-
D.16.9	4-フェノキシベンズアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(ベンジロキシカルボニルアミド)エチル]-
D.17	4-ブチルベンズアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(アミノエチル)-塩酸塩
D.18	2-S-(4-ブチルベンゾイルアミノ)-3-(2-ピラジノカルボニルアミノ)-N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]
D.19	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[4-フルオロ-ベンゼンスルホンアミド]エチル]-
D.20	4-ブチルベンズアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(2,5-ジメチル-2H-ピラゾール)カルボニルアミノ]エチル]-
D.21	4-ブチルベンズアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(4-メチルフェニルウリエドスルホニルアミノ)エチル]-
D.22	4-フェノキシベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(3-フェニルウレイド)エチル]-
D.23	4-ブチルベンズアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(4-メチルフェニルスルホニルウレイド)エチル]-
D.24.1	デカンアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[4-フルオロ-ベンゼンスルホンアミド]エチル]-
D.24.2	デカンアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(4-スルホンアミドフェニル)カルボニルアミド]エチル]-

【表 2 - 5】

D.24.3	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(アセトアミド)エチル]-
D.24.4	4-ブチルベンズアミド(N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(メタンスルホンアミド)エチル]-
D.24.5	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(プロピルウレイド)エチル]-
D.24.6	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(4-メチルフエニル)カルボニルアミノ]エチル]-
D.24.7	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(1,1-ジメチルエトキシカルボニル)アミノ]エチル]-
D.24.8	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(チエン-2-イルカルボニル)アミノ]エチル]-
D.24.9	デカンアミド(N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(チエン-2-イルカルボニル)アミノ]エチル]-
D.24.10	4-ブチルベンズアミド(N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(ヘキサノールアミノ)エチル]-
D.24.11	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(シクロプロパンカルボニルアミノ)エチル]-
D.24.12	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(3-フェニルウレイド)エチル]-
D.24.13	4-ブチルベンズアミド(N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(N-メチル-2-ピロリルカルボニルアミド)エチル]-
D.24.14	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(3,4-ジメトキシフェニル)アセチルアミノ]エチル]-

【表 2 - 6】

D.24.15	4-ブチルベンズアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(ニコチノニルアミノ)エチル]-
D.24.16	4-ブチルベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(4-スルホニルアミノ)ベンゾイルアミノ]エチル]-
D.24.17	4-ブチルベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(1H-テルタゾル-5-イル-アセチルアミノ]エチル]-
D.24.18	4-ブチルベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(4-メチルスルホニルフェニル)カルボニルアミノ]エチル]-
D.24.19	デカンアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(ニコチノニルアミノ)エチル]-
D.24.20	4-ブチルベンズアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(4-(2H-テトラゾル-5-イル)フェニル)カルボニルアミノ]エチル]-
D.24.21	4-ブチルベンズアミド, (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(1-イソキサゾル-5-イル)-カルボニルアミノ]エチル]-
D.24.22	4-ブチルベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(4-シアノフェニル)スルホニルアミノ]エチル]-
D.24.23	4-ブチルベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(1-メチル-1H-イミダゾール-4-)スルホニルアミノ]エチル]-
D.24.24	4-ブチルベンズアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(2-チオフェン)スルホニルアミノ]エチル]-
D.24.25	4-ブチルベンズアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(6-モルフォリン-4-ニコチノイルアミノ)エチル]-

【表 2 - 7】

D.24.26	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(2-ピリジン-4-チアゾールカルボニルアミノ)エチル]-
D.24.27	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(4-メチルフエニルウリエドスルホニルアミノ)エチル]-
D.24.28	4-フェノキシベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(ベンジロキシカルボニルアミド)エチル]-
D.24.29	4-フェノキシベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[4-フルオロ-ベンゼンスルホンアミド]エチル]-
D.24.30	4-フェノキシベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(2,5-ジメチル-2H-ピラゾール)カルボニルアミノ]エチル]-
D.24.31	4-フェノキシベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(4-フェニルベンゾイルアミノ)エチル]-
D.24.32	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(4-フェニルベンゾイルアミノ)エチル]-
D.24.33	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(3-フェニルプロピノイルアミノ)エチル]-
D.24.34	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(2-ヒドロキシ-3-ニコチノイルアミノ)エチル]-
D.24.35	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(D-ピログルタモイルアミノ)エチル]-
D.24.36	4-ブチルベンズアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(1-メタンスルホニル-ピペリジン-4-カルボニルアミノ)エチル]-
D.24.37	デカンアミド、N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(3-フェニル-ウレイド)エチル]-

【表 2 - 8】

D.24.38	デカンアミド (N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(アセトアミド)エチル]-
D.25.1	デカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-アミノ]エチル] (塩酸塩)
D.25.2	デカンアミド, N-[(1S)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,aS,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-アミノ]エチル] (塩酸塩)
D.26	4-ブチルベンズアミド、(N-[(1R)-1-[[[(1R)-1-[(3aS,4S,6S,7aR)-ヘキサヒドロ-3a,5,5-トリメチル-4,6-メタノ-1,3,2-ベンゾジオキサボロル-2-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-[(4-メチルベンゾイル)アミノ]エチル]-)
E.1.23	ボロン酸、[(1R)-1-[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(4-フェニルブタノイル)アミノ]-1-オキソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.24	ボロン酸、[(1R)-1-[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(ウンデシルアミノカルボニル)アミノ]-1-オキソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.25	ボロン酸、[(1R)-1-[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(1-ブromo-2-ナフトイル)アミノ]-1-オキソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.26	ボロン酸、[(1R)-1-[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(6-ブromo-2-ナフトイル)アミノ]-1-オキソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.27	ボロン酸、[(1R)-1-[(2S)-3-カルバモイル-2-[(デカノイル)アミノ]-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.28	ボロン酸、[(1R)-1-[(2S)-3-カルバモイル-2-[4-ブチル(ベンゾイル)アミノ]-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.29	ボロン酸、[(1R)-1-[(2S)-2-[(デカノイル)アミノ]-1-オキソ-5-ウレイド-ペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.1.30	ボロン酸、[(1R)-1-[(2S)-2-[(4-ブチルベンゾイル)アミノ]-1-オキソ-5-ウレイド-ペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.76	ボロン酸、[(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(RS)-2-(4-クロロフェニル)プロパノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.77	ボロン酸、[(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[2-(4-ブromoフェノキシ)アセチル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.78	ボロン酸、[(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[3-(4-エチルフェニル)プロパノイル]アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.79	ボロン酸、[(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[3-[4-(ヘブチロキシ)フェニル]-ウレイド]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.2.80	ボロン酸、[(1R)-1-[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[(5-オキソヘキサノイル)アミノ]-1-オキソペンチル]アミノ]-3-メチルブチル]

【表 2 - 9】

E.2.81	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-5-[[イミノ(ニトロアミノ)メチル]アミノ]-2-[[[(2RS)-1-[[1,1-ジメチルエトキシ]カルボニル]ピペリジン-2-カルボニル]アミノ]-1-オキシソベンチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.3.1	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(2-ナフトイル)アミノ]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.3.2	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(p-トリロキシアセトアミド]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.3.3	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(トリデカノイル)アミノ]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.3.4	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(ナフタレン-2-スルホニル)アミノ]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.3.5	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(4-フェニルベンゾイル)アミノ]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.3.6	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(2,2ジメチル-デカノイル)アミノ]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.3.7	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(4-フェノキシベンゾイル)アミノ]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.3.8	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(4-(1-プロポキシ)ブチルベンゾイル)アミノ]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.3.9	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(3-ピリジン-3-イル-ベンゾイル)アミノ]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル](塩酸塩)
E.3.10	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(3-プロポキシ-ベンゾイル)アミノ]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.3.11	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(3-フェニルベンゾイル)アミノ]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.3.12	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(4-(2-フルオロフェニル)ベンゾイル)アミノ]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.4	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(4-(3-ピリジル)ベンゾイル)アミノ]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.4.1	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(2-ピラジニカルボニル)アミノ]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.4.2	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(5-ブチル-ピリジン-2-カルボニル)アミノ]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.4.3	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S,3R)-3-ヒドロキシ-2-[(6-フェニル-ピリジン-2-カルボニル)アミノ]-1-オキシソブチル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(2-ピラジニカルボニルアミノ)-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキシソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.1	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(アセチルアミノ)-2-[(デカノイルアミノ)-1-オキシソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]

【表 2 - 1 0】

E.5.2	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(プロピルウレイド)-2-[(4-ブチル)-ベンゾイルアミノ]-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.3	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(メタンスルホアミド)-2-[(4-ブチル)-ベンゾイルアミノ]-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.4	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-[2-(1H-ピラゾール)エチル]-2-[(4-ブチル)-ベンゾイルアミノ]-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.5	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(メタンスルホアミド)-2-[(4-ブチル)-ベンゾイルアミノ]-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.6	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-[(カルボベンジロキシアミノ)-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.7	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-[(チエン-2-イルカルボニル)アミノ]-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.8	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(アセチルアミノ)-2-[4-ブチル-ベンゾイルアミノ]-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.9	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-[(チエン-2-イルカルボニル)アミノ]-2-[(デカノイルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.10	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(ヘキサノイルアミノ)-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.11	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-[4-フルオロ-ベンゼンスルホンアミド]-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.12	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-[4-フルオロ-ベンゼンスルホンアミド]-2-[(デカノイルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.13	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(ヘキサノイルアミノ)-2-[(デカノイルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.14	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(ヘキサノイルアミノ)-2-[(シクロプロパンカルボニルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル] 3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-(シクロプロパンカルボニルアミノ)エチル]-
E.5.15	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-[(3,4-ジメトキシフェニル)アセチルアミノ]-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.16	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-[1-N-メチル-2-ピロリルカルボニルアミノ]-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.17	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-[4-スルファマイルベンゾイルアミノ]-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.18	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(ニコチノイルアミノ)-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.19	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(3-フェニルウレイド)-2-(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.20	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-[(4-メチルスルホニル)ベンゾイルアミノ]-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]

【表 2 - 1 1】

E.5.21	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(3-フェニルウレイド)-2-(デカノイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.22	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(ニコチノイルアミノ)-2-(デカノイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.23	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2R)-3-(4-メチルフェニルカルボニル)-2-(デカノイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.24	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-[4-(1H-テトラゾリル)-フェニルカルボニルアミノ]-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.25	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(2-イソキサゾリルカルボニルアミノ)-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.26	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-[1-メチル-1H-イミダゾール-4-スルファモイル]-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.27	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-[6-モルフォリン-4-イル-ピリジン-3-スルファモイル]-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]塩酸塩]
E.5.28	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(6-モルフォリノニコチンアミド)-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.29	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(4-(1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-カルボニルアミノ)-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]塩酸塩]
E.5.30	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-[4-フルオロ-ベンゼンスルホンアミド]-2-[(4-フェノキシベンゾイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.31	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(4-(1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-カルボニルアミノ)-2-[(4-フェノキシベンゾイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]カルボニルアミノ]エチル]-
E.5.32	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(4-フェニルウレイド)-2-[(4-フェノキシベンゾイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.33	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(4-フェニルベンズアミド)-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.34	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(4-フェニルベンズアミド)-2-[(4-フェノキシベンゾイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.35	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(フェニルプロピオンアミド)-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.36	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(4-メチルフェニルスルホニル)-ウレイド]-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.37	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(4-(2-(4-ピリジル)-1,3-チアゾール-4-カルボニルアミノ)-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)-1-オキソプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]

【表 2 - 1 2】

E.5.38	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(1-メタンスルホニルピペリジン-4-カルボニルアミノ)-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)]-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.39	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-[(2-チオフェン)スルホニルアミノ]-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)]-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.40	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(4-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ベンゾイルアミド)]-2-[(4-ブチルベンゾイルアミノ)]-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]塩酸塩
E.5.41	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2R)-3-(4-メチルフェニルカルボニル)-2-(デカノイルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.42	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-(4-フェニルウレイド)-2-(デカノイルアミノ)-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
E.5.43	ボロン酸、[(1R)-1-[[[(2S)-3-アセチルアミノ-2-デカノイルアミノ-1-オキシプロピル]アミノ]-3-メチルブチル]
F.2.1	4-ブチルベンズアミド(N-[[[(1S,2R)-1-[[[(1R)-1-[13,15-ジオキサ-14-ボラジスピロ[5.0.5.3]ペンタデカ-14-イル]-3-メチルブチル]アミノ]カルボニル]-2-ヒドロキシプロピル]-

または薬学的に許容可能なその塩、またはその遊離塩基。

【請求項 8 4】

請求項 1 ～ 8 3 記載のいずれか 1 つの化合物と、薬学的に許容可能な担体とを有する組成物。

【請求項 8 5】

プロテアソームの活性を阻害する方法であって、この方法は、

請求項 1 ～ 8 3 記載のいずれか 1 つの化合物を前記プロテアソームと接触させる工程を有するものである。

【請求項 8 6】

癌を有するか、癌にかかりやすい哺乳類の癌を治療するための請求項 1 ～ 8 3 記載のいずれか 1 つの化合物を有する薬学的組成物。

【請求項 8 7】

請求項 8 6 記載の薬学的組成物において、前記癌は、皮膚、前立腺、結腸直腸、膵臓、腎臓、卵巣、哺乳類、肝臓、舌、肺、平滑筋組織から選択されるものである。

【請求項 8 8】

請求項 8 6 記載の薬学的組成物において、前記癌は、白血病、リンパ腫、非ホジキンリンパ腫、骨髄腫、多発性骨髄腫から選択されるものである。

【請求項 8 9】

請求項 8 6 記載の薬学的組成物であって、この薬学的組成物は、さらに、

1 若しくはそれ以上の抗腫瘍剤または制癌剤および／または放射線療法と併用するものである。

【請求項 9 0】

タンパク質分解を抑制する方法であって、この方法は、

請求項 1 ～ 8 3 記載のいずれか 1 つの化合物を前記タンパク質を分解することができるプロテアソームと接触させる工程を有するものである。

【請求項 9 1】

請求項 9 0 記載の方法において、前記タンパク質は、ユビキチンで標識されているものである。

【請求項 9 2】

請求項 9 0 記載の方法において、前記タンパク質は、p 5 3 である。

【請求項 9 3】

タンパク質分解の促進または亢進を有するか、前記タンパク質分解が促進または亢進しやすい哺乳類に対して、タンパク質分解の促進または亢進を治療するための請求項 1 ～ 8 3 記載のいずれか 1 つの化合物を有する薬学的組成物。

【請求項 9 4】

転写因子 NF-κB の阻害剤 I κB を請求項 1 ～ 8 3 記載のいずれか 1 つの化合物と接触させる工程を有する、転写因子 NF-κB の活性を阻害する方法。

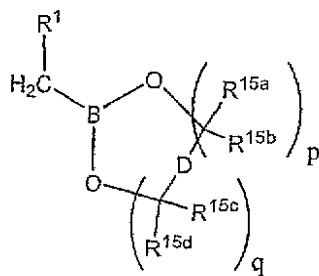
【請求項 9 5】

移植拒絶反応、関節炎、感染、炎症性大腸炎、喘息、骨粗鬆症、骨関節炎、乾癬、再狭窄、または自己免疫疾患から生じるヒト免疫不全ウイルス (HIV) 感染または炎症性疾患から選択された疾患を治療するための請求項 1 ～ 8 3 記載のいずれか 1 つの化合物を有する薬学的組成物。

【請求項 9 6】

化学式 (I I) の化合物を調整する方法であって、

【化 8】



(II)

式中、

D は存在しないか、O、S、NR^{1 6}、または CR^{1 5 e} R^{1 5 f} であり、

R¹ は C₁ - C₈ アルキル、C₂ - C₈ アルケニル、C₂ - C₈ アルキニル、または C₃ - C₇ シクロアルキルであり、

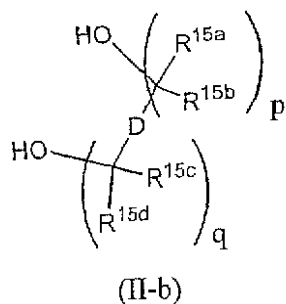
R^{1 5 a}、R^{1 5 b}、R^{1 5 c}、R^{1 5 d}、R^{1 5 e}、R^{1 5 f} はそれぞれ個別に H、C₁ - C₁₀ アルキル、C₃ - C₇ シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールであり、前記 C₁ - C₁₀ アルキル、C₃ - C₁₀ シクロアルキル、アリール、またはヘテロアリールはそれぞれ選択的に 1、2、3、または 4 ハロ、C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ アルコキシ、C₁ - C₄ ハロアルコキシ、OH、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリール、またはヘテロアリールで置換され、

または R^{1 5 a} および R^{1 5 b} と、前記 C 原子に R^{1 5 a} および R^{1 5 b} が C₃ - C₁₀ シクロアルキルまたは 3 ～ 10 員環のヘテロシクロアルキル基から結合され、それぞれ選択的に 1、2、3 または 4 ハロ、C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ アルコキシ、C₁ - C₄ ハロアルコキシ、OH、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリール、またはヘテロアリールで置換され、

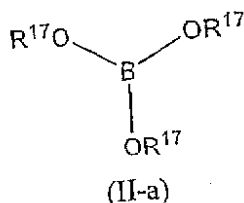
または R^{1 5 a} および R^{1 5 b} と、前記 C 原子に R^{1 5 a} および R^{1 5 b} が C₃ - C₁₀ シクロアルキルまたは 3 ～ 10 員環のヘテロシクロアルキル基から結合され、それぞれ選択的に 1、2、3 または 4 ハロ、C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ アルコキシ、C₁ - C₄ ハロアルコキシ、OH、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリール、またはヘテロアリールで置換され、

または R^{1 5 a} および R^{1 5 b} と、R^{1 5 a} および R^{1 5 b} が結合された前記 C 原子、およびアリール、ヘテロアリール、C₃ - C₁₀ シクロアルキルまたは 3 ～ 10 員環のヘテロシクロアルキル基の介在性 D 部分が、それぞれ選択的に 1、2、3 または 4 ハロ、C₁ - C₄ アルキル、C₁ - C₄ アルコキシ、C₁ - C₄ ハロアルコキシ、OH、アミノ、

アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリール、またはヘテロアリールで置換され、
 R^{16} はHまたは $C_1 - C_6$ アルキルであり、
 p と q はそれぞれ個別に 1、2、または 3 であって、この方法は、
 a) 化学式 (II-b) のジオールを、
 【化 9】



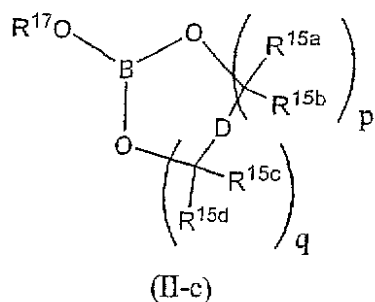
化学式 (II-a) の適切なトリアルコキシボランと反応させる工程であって、
 【化 10】



式中、 R^{17} はそれぞれ個別に $C_1 - C_{10}$ アルキルまたは $C_3 - C_{10}$ シクロアルキルであって、

ここで、前記反応は、化学式 (II-c) の中間体を形成するために適切な時間及び条件下におけるものである、前記反応させる工程と、

【化 11】



b) 化学式 (II) の化合物の形成するために適切な時間と条件下において、化学式 (II-c) の中間体と、
 i) 化学式 $R^1 CH_2 M X^{h a 1}$ の試薬 (式中、M は金属、 $X^{h a 1}$ はハロゲン)、または
 ii) 化学式 $R^1 CH_2 Li$ の試薬とを反応させる工程と、
 を有する、方法。

【請求項 97】

請求項 96 記載の方法において、 R^{17} は $C_1 - C_4$ アルキルである。

【請求項 98】

請求項 96 記載の方法において、 R^{17} はイソプロピルである。

【請求項 99】

請求項 96 記載の方法において、前記化学式 (II-b) のジオールは、ピナンジオール

ル、ピナコール、1, 2-エタンジオール、1, 3-プロパンジオール、1, 2-プロパンジオール、2, 3-ブタンジオール、1, 1, 2, 2-テトラメチルエタンジオール、1, 2-ジイソプロピルエタンジオール、5, 6-デカンジオール、1, 2-ジシクロヘキシルエタンジオール、ビシクロヘキシル-1, 1'-ジオール、ジエタノールアミン、または1, 2-ジフェニル-1, 2-エタンジオールである。

【請求項100】

請求項96記載の方法において、化学式 (II-b) のジオールはピナンジオールである。

【請求項101】

請求項96記載の方法において、 $R^1CH_2MX^{h a 1}$ は R^1CH_2MgBr である。

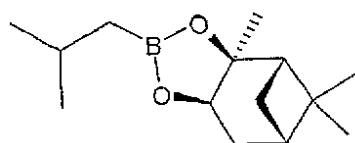
【請求項102】

請求項96記載の方法において、 R^{17} はイソプロピルである。

【請求項103】

化学式 (II-i) の化合物を調整するための請求項96記載の方法であって、

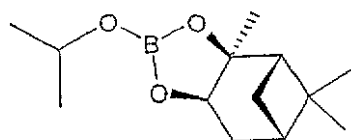
【化12】



(II-i)

a) 化学式 (II-ii) の中間体を形成するために適した時間と条件下で、(1S, 2S, 3R, 5S) - (+) - ピナンジオールとトリイソプロポキシボランとを反応させる工程と、

【化13】



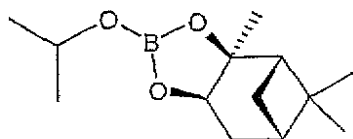
(II-ii)

b) 化学式 (II-i) の中間体を形成するのに適した時間と条件下で、化学式 (II-ii) の中間体とイソブチル臭化マグネシウムとを反応させる工程とを有する、方法。

【請求項104】

化学式 (II-ii) の化合物。

【化14】

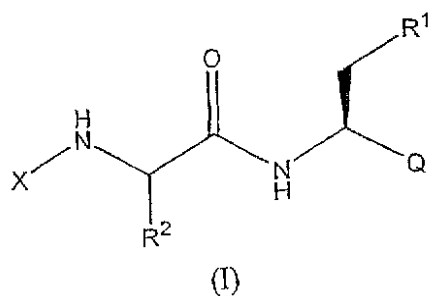


(II-ii).

【請求項105】

化学式 (I) の化合物を調整する方法であって、

【化 15】



式中、

R^1 は $C_1 - C_8$ アルキル、 $C_2 - C_8$ アルケニル、 $C_2 - C_8$ アルキニル、または $C_3 - C_7$ シクロアルキルであり、

R^2 は $-CH_2NH_2$ であり、

Q は $-B(OR^{1-4})_2$ 、またはサイクリックボロン酸エステルであり、前記サイクリックボロン酸エステルは 2 ～ 20 個の炭素原子と、選択的に N、S、または O のヘテロ原子を とを含み、

R^{1-4} は $C_1 - C_4$ アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、またはアラキルであり、

X は $R^A C(=O)-$ であり、

R^A は 選択的に R^{2-0} で置換された $C_1 - C_{20}$ アルキル、選択的に R^{2-0} で置換された $C_2 - C_{20}$ アルケニル、選択的に R^{2-0} で置換された $C_2 - C_{20}$ アルキニル、1 ～ 5 個の R^{2-1} で 選択的に 置換されたカルボシクリル、または 1 ～ 5 個の R^{2-1} で 選択的に 置換されたヘテロカルボシクリルであり、

R^{2-0} は、 $-CN$ 、ハロ、ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、 $-CO_2H$ 、 $-C(=O)CO_2H$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=O)H$ 、 $-S(=O)NH_2$ 、 $-S(=O)_2NH_2$ 、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH$ (アルキル)、 $-N$ (アルキル) $_2$ 、 $-NHC(=O)NH_2$ 、 $-NHC(=O)R^{2-0a}$ 、 $-NHC(=O)OR^{2-0a}$ 、 $-OR^{2-0a}$ 、 $-SR^{2-0a}$ 、 $-S(=O)R^{2-0a}$ 、 $-S(=O)_2R^{2-0a}$ 、 $-S(=O)_2-NHR^{2-0a}$ 、 $-SC(=O)R^{2-0a}$ 、 $-C(=O)R^{2-0a}$ 、 $-C(=O)NHR^{2-0a}$ 、 $-C(=O)O-R^{2-0a}$ 、 $-NHS(=O)_2R^{2-0a}$ 、 $-NHR^{2-0b}$ 、フタルイミド、 $-(O-アルキル)_r$ 、 $-O-アルキル-OH$ 、 $-(O-アルキル)_r-OH$ 、 $-OR^{2-0c}$ 、 $-SR^{2-0c}$ 、 $-O-アルキル-R^{2-0c}$ 、 $-S-アルキル-R^{2-0c}$ 、 $-S(=O)-R^{2-0c}$ 、 $-S(=O)_2-R^{2-0c}$ 、 $-S(=O)_2-NHR^{2-0c}$ 、 $-SC(=O)R^{2-0c}$ 、 $-C(=O)R^{2-0c}$ 、 $-C(=O)OR^{2-0c}$ 、 $-C(=O)NHR^{2-0c}$ 、1 ～ 5 個の R^{2-1} で 選択的に 置換されたカルボシクリル、および 1 ～ 5 個の R^{2-1} で 選択的に 置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され、

R^{2-0a} は、 $C_1 - C_{20}$ アルキル、 $C_2 - C_{20}$ アルケニル、または $C_2 - C_{20}$ アルキニルであり；前記アルキル、アルケニル、またはアルキニルは 選択的に 1 若しくはそれ以上のハロ、 $C_1 - C_4$ アルキル、アリール、ヘテロアリールまたは $-NHR^{2-0b}$ で置換され、

R^{2-0b} はアミノ保護基であり、

R^{2-0c} は 1 ～ 5 個の R^{2-1} で 選択的に 置換されたカルボシクリル、または 1 ～ 5 個の R^{2-2} で 選択的に 置換されたヘテロカルボシクリルであり、

R^{2-1} は、 $C_1 - C_{20}$ アルキル、 $C_2 - C_{20}$ アルケニル、 $C_2 - C_{20}$ アルキニル、 $C_1 - C_{20}$ アルコキシ、 $C_1 - C_{20}$ チアルコキシ、 $-OH$ 、 $-CN$ 、ハロ、ハロアルキル、 $-NH_2$ 、 $-NH$ (アルキル)、 $-N$ (アルキル) $_2$ 、 $-NHC(=O)O-アルキル$ 、 $-NHC(=O)アルキル$ 、 $-C(=O)O-アルキル$ 、 $-C(=O)アルキル$ 、 $-S(=O)-アルキル$ 、 $-S(=O)_2-アルキル$ 、 $-S(=O)-アリール$ 、 $-S$

(=O)₂ -アリール、1～5個のR²で選択的に置換されたカルボシクリル、および1～5個のR²で選択的に置換されたヘテロカルボシクリルから成る群から選択され、
 R²は、C₁-C₁₀アルキル、C₂-C₁₀アルケニル、C₂-C₁₀アルキニル、フェニル、ハロ、ハロアルキル、アルコキシ、チアルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、カルボキシル、アルキル-O-C(=O)-、アルキル-C(=O)-、アリール-O-C(=O)-、アルキル-O-C(=O)-NH-、アリール-O-C(=O)-NH-、アルキル-C(=O)-NH-、アルキル-C(=O)-O-、(アルキル-O)_r-アルキル、HO-(アルキル-O)_r-アルキル、-OH、-SH、-CN、-N₃、-CNO、-CNS、アルキル-S(=O)-、アルキル-S(=O)₂-、H₂NS(=O)-、またはH₂NS(=O)₂-から成る群から選択され、
 rは2、3、4、または5であって、

化学式(I)の化合物の形成に適した時間と条件下で、化学式(I)の化合物(式中、R²は-CH₂NH-C(=O)OCH₂(C₆H₅))と適切な水素化剤とを反応させる工程を有し、前記水素化剤はR²のベンジロキシカルボニル基に対して選択的であるという条件で、式中、R²は-CH₂NH₂である、方法。

【請求項106】

請求項105記載の工程において、前記水素化剤はPd/C 10%およびHClの1, 4-ジオキサン溶液である。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0014

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0014】

前記参考文献で証明されているとおり、プロテアソーム活性を調節することができる薬物に大きな利益がある。例えば、プロテアソーム活性を阻害することができる分子は、細胞サイクルのタンパク質または腫瘍抑制因子の規則的な分解で干渉することにより、癌の抑制を停止または遅延させることができる。従って、プロテアソームの新しいおよび/または改善した阻害剤を継続的に必要としている。

この出願の発明に関連する先行技術文献情報としては、以下のものがある(国際出願日以降国際段階で引用された文献及び他国に国内移行した際に引用された文献を含む)。

【特許文献1】国際公開第04/026407号パンフレット

【特許文献2】欧州特許第0478507. 6号明細書

【特許文献3】ペルー第00784-2004号明細書

【特許文献4】米国特許第5, 614, 649号明細書

【特許文献5】米国特許第5, 830, 870号明細書

【特許文献6】米国特許第5, 990, 083号明細書

【特許文献7】米国特許第6, 096, 778号明細書

【特許文献8】米国特許第6, 310, 057号明細書

【特許文献9】米国特許出願公開第2001/00012854号明細書

【特許文献10】米国特許第4, 499, 082号明細書

【特許文献11】米国特許第4, 537, 773号明細書

【特許文献12】米国特許第5, 106, 948号明細書

【特許文献13】米国特許第5, 169, 841号明細書

【特許文献14】米国特許第5, 693, 617号明細書

【特許文献15】米国特許第5, 834, 487号明細書

【特許文献16】米国特許第6, 075, 150号明細書

【特許文献17】米国特許第6, 083, 903号明細書

【特許文献18】米国特許第6, 297, 217号明細書

【特許文献19】米国特許第5, 780, 454号明細書

- 【特許文献20】 米国特許第6, 066, 730号明細書
- 【特許文献21】 米国特許第6, 297, 217号明細書
- 【特許文献22】 米国特許第6, 548, 668号明細書
- 【特許文献23】 米国特許出願公開第2002/0173488号明細書
- 【特許文献24】 国際公開第99/30707号パンフレット
- 【特許文献25】 国際公開第91/13904号パンフレット
- 【特許文献26】 国際公開第95/25333号パンフレット
- 【特許文献27】 国際公開第94/17816号パンフレット
- 【特許文献28】 国際公開第00/64863号パンフレット
- 【特許文献29】 欧州特許第01166781号明細書
- 【特許文献30】 欧州特許第0995757号明細書
- 【特許文献31】 国際公開第00/64467号パンフレット
- 【特許文献32】 国際公開第02/096933号パンフレット
- 【特許文献33】 米国特許第6, 465, 433号明細書
- 【特許文献34】 米国特許出願公開第2002/188100号明細書
- 【特許文献35】 米国特許第5, 250, 720号明細書
- 【特許文献36】 米国特許第5, 242, 904号明細書
- 【特許文献37】 米国特許第5, 187, 157号明細書
- 【特許文献38】 米国特許第5, 159, 060号明細書
- 【特許文献39】 米国特許第5, 106, 948号明細書
- 【特許文献40】 米国特許第4, 963, 655号明細書
- 【特許文献41】 米国特許第4, 499, 082号明細書
- 【特許文献42】 米国特許第5, 658, 885号明細書
- 【特許文献43】 米国特許第5, 580, 486号明細書
- 【特許文献44】 米国特許第5, 470, 864号明細書
- 【特許文献45】 米国特許第5, 585, 390号明細書
- 【特許文献46】 米国特許第5, 550, 262号明細書
- 【特許文献47】 米国特許第5, 023, 236号明細書
- 【特許文献48】 米国特許第6, 372, 883号明細書
- 【特許文献49】 米国特許出願公開第2003/008828号明細書
- 【特許文献50】 国際公開第96/13266号パンフレット
- 【特許文献51】 国際公開第01/002424号パンフレット
- 【特許文献52】 国際公開第89/09225号パンフレット
- 【特許文献53】 国際公開第98/17679号パンフレット
- 【特許文献54】 国際公開第98/22496号パンフレット
- 【特許文献55】 国際公開第00/66557号パンフレット
- 【特許文献56】 国際公開第02/059130号パンフレット
- 【特許文献57】 国際公開第03/15706号パンフレット
- 【特許文献58】 国際公開第96/12499号パンフレット
- 【特許文献59】 国際公開第95/20603号パンフレット
- 【特許文献60】 国際公開第95/09838号パンフレット
- 【特許文献61】 国際公開第94/25051号パンフレット
- 【特許文献62】 国際公開第94/25049号パンフレット
- 【特許文献63】 国際公開第94/04653号パンフレット
- 【特許文献64】 国際公開第02/08187号パンフレット
- 【特許文献65】 欧州特許第632026号明細書
- 【特許文献66】 欧州特許第354522号明細書
- 【特許文献67】 欧州特許第293881号明細書
- 【特許文献68】 欧州特許第315574号明細書
- 【特許文献69】 国際公開第01/20995号パンフレット

- 【特許文献70】国際公開第02／094857号パンフレット
- 【特許文献71】国際公開第96／14857号パンフレット
- 【特許文献72】国際公開第96／11697号パンフレット
- 【特許文献73】国際公開第03／015706号パンフレット
- 【特許文献74】国際公開第02／059131号パンフレット
- 【特許文献75】国際公開第02／82091号パンフレット
- 【特許文献76】国際公開第02／030455号パンフレット
- 【特許文献77】国際公開第01／28579号パンフレット
- 【特許文献78】国際公開第00／23614号パンフレット
- 【特許文献79】国際公開第00／02548号パンフレット
- 【特許文献80】国際公開第95／09634号パンフレット
- 【特許文献81】国際公開第03／059898号パンフレット
- 【特許文献82】独国特許出願公開第19914474号明細書
- 【特許文献83】国際公開第96／14857号パンフレット
- 【特許文献84】国際公開第99／30707号パンフレット
- 【特許文献85】国際公開第05／016859号パンフレット
- 【特許文献86】国際公開第03／033507号パンフレット
- 【特許文献87】米国特許第5、550、262号明細書
- 【特許文献88】米国特許第5、614、649号明細書
- 【特許文献89】オーストリア特許第241998号明細書
- 【特許文献90】豪州特許第710437号明細書
- 【特許文献91】豪州特許第4110496号明細書
- 【特許文献92】ブラジル特許第9509665号明細書
- 【特許文献93】カナダ特許第2202760号明細書
- 【特許文献94】独国特許第69530993号明細書
- 【特許文献95】独国特許第69530993号明細書
- 【特許文献96】デンマーク特許第789578号明細書
- 【特許文献97】欧州特許第0789578号明細書
- 【特許文献98】スペイン特許第2200010号明細書
- 【特許文献99】フィンランド特許第972029号明細書
- 【特許文献100】特許第3056258号明細書
- 【特許文献101】特許第10507465号明細書
- 【特許文献102】特開平12-290197号公報
- 【特許文献103】ノルウェー特許第972104号明細書
- 【特許文献104】ニュージーランド特許第296479号明細書
- 【特許文献105】ポルトガル特許第789578号明細書
- 【特許文献106】国際公開第9614857号パンフレット
- 【特許文献107】米国特許第5、830、870号明細書
- 【特許文献108】米国特許第5、990、083号明細書
- 【非特許文献1】タナカ (Tanaka)、Biochem Biophys. Res. Commun.、1998年、第247巻、p. 537
- 【非特許文献2】リベット (Rivett)、Biochem J.、1993年、第291号、p. 1
- 【非特許文献3】ムラー (Muller) ら、サイエンス誌 (Science)、1995年、268号、p. 579
- 【非特許文献4】ゴールドバーグ (Goldberg) ら、ネイチャー誌 (Nature)、1992年、357号、p 375
- 【非特許文献5】コウ、エル (Ko, L)、J. Genes Dev.、1996年、第10巻、p. 1054
- 【非特許文献6】オレン、エム. (Oren, M.)、Semin. Cancer Bi

ol.、1994年、第5巻、p. 221

【非特許文献7】キセレブ (Kisseliev) ら、Chemistry & Biology、2001年、第8巻、p. 739

【非特許文献8】フェンテニー (Fenteny) ら、サイエンス誌 (Science)、1995年、268号、p. 726

【非特許文献9】フェンテニー (Fenteny) ら、Proc. Natl. Acad. Sci. 米国 (USA)、1994年、第91巻、p. 3358

【非特許文献10】パロムベラ (Palombella) ら、セル誌 (Cell)、1994年、第78巻、p. 773

【非特許文献11】ヴィニスキー (Vinitsky) ら、Biochemistry、1992年、31号、p. 9421

【非特許文献12】ツブキ (Tsubuki) ら、Biochem. Biophys. Res. Commun.、1993年、第196巻、p. 1195

【非特許文献13】ロック (Rock) ら、セル誌 (Cell)、1994年、第78巻、p. 761

【非特許文献14】イクバル (Iqbal) ら、J. Med. Chem.、1995年、第38巻、p. 2276

【非特許文献15】イクバル (Iqbal) ら、Bioorg. Med. chem. Lett.、1996年、第6巻、p. 287

【非特許文献16】ケトナー (Kettner) ら、J. biol. Chem.、1994年、第259巻、第24号、p. 15106

【非特許文献17】アダムス (Adams) ら、「プロテアソームの強力且つ選択的阻害：ジペプチジルボロン酸 (Potent And Selective Inhibitors Of The Proteasome: Dipeptidyl Boronic Acids)」、Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters.、1998年、第8巻、第4号、p. 333-338

【非特許文献18】アオヤギ (Aoyagi) ら、「微生物起源のプロテアーゼ阻害剤 (Structures and activities of protease inhibitors of microbial origin)」、Proteases And Biological Control、1975年、p. 429-454

【非特許文献19】アトウッド (Attwood) ら、「C型肝炎ウイルスNS3-4Aプロテイナーゼの強力阻害剤の設計及び合成 (The Design And Synthesis Of Potent Inhibitors Of Hepatitis C Virus NS3-4A Proteinase)」、Antiviral Chemistry & Chemotherapy、1999年、第10巻、第5号、p. 259-273

【非特許文献20】クリスティー (Christie) ら、「アルツハイマー病：培養細胞においてプロテアソームのキモトリプシン様活性の阻害を用いたβ-アミロイドペプチド分泌の抑制における相互関係 (Alzheimer's Disease: Correlation Of The Suppression Of β-Amyloid peptide Secretion From Cultured Cells With Inhibition Of The Chymotrypsin-Like Activity Of The Proteasome)」、J. Of Neurochemistry、1999年、第73巻、第1号、p. 195-204

【非特許文献21】ディック (Dick) ら、「マルチプロテイナーゼ複合体マクロペイン (プロテアソーム) による酸化インシュリンB鎖の分解 (Degradation of oxidized insulin B chain by the multiprotease complex macropain (proteasome))」、Biochemistry、1991年3月12日、第30巻、第10号、p. 2725-34

【非特許文献22】ダドソン (Dudson) ら、「アミノボロン酸の固相合成：C型肝炎ウイルスNS3プロテイナーゼの強力な阻害剤 (Solid Phase Synthesis Of Aminoboronic Acids: Potent Inhibitors Of The Hepatitis C Virus NS3 Proteinase)」、Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters、2000年、第10巻、第14号、p. 1577-1579

【非特許文献23】エヴァラルド・トデスティ (Evarado-Todeschi) ら、「ケトリデスHMR 3647 (テリスロマイシン) 及びRU72366のバクテリアリボソームに対する結合と溶液中の構造：新規超強力抗菌剤 (Conformations In Solution And Bound To Bacterial Ribosomes Of Ketolides, HMR 3647 (Telithromycin) And RU 72366: A New Class Of Highly Potent Antibacterials)」、Bioorg. Med. Chem.、2000年7月、第8巻、第7号、p. 1579-97

【非特許文献24】フェンテニー (Fenteany) ら、「プロテアソーム活性の阻害、及びラクタシスチンによるサブユニット特異的アミノ末端スレオニン修飾 (Inhibition of proteasome activities and subunit-specific amino-terminal threonine modification by lactacystin)」、サイエンス誌 (Science)、1995年5月5日、第268巻、第5211号、p. 726-31

【非特許文献25】フェンテニー (Fenteany) ら、「ベータラクトン関連ラクタシスチンによる神経芽細胞腫細胞株における神経突起増殖の誘導、及び骨肉腫細胞株における細胞サイクル亢進 (A beta-lactone related to lactacystin induces neurite outgrowth in a neuroblastoma cell line and inhibits cell cycle progression in an osteosarcoma cell line)」、Proc Natl Acad Sci、1994年4月12日、第91巻、第8号、p. 3358-62

【非特許文献26】ガルシア (Garcia) ら、「プロテアソーム20Sのキモトリプシン様活性の選択的且つ非共有阻害剤の新たな構造的分類 (A new structural class of selective and non-covalent inhibitors of the chymotrypsin-like activity of the 20S proteasome)」、Bioorg Med Chem Lett.、2001年5月21日、第11巻、第10号、p. 1317-9

【非特許文献27】ガードナー (Gardner) ら、「哺乳類20S及び26Sのペプチジルボロン酸阻害剤、及び培養細胞におけるプロテアソームの素アイソフォームに関する解析 (Characterization of peptidyl boronic acid inhibitors of mammalian 20S and 26S proteasomes and their inhibition of proteasomes in cultured cells)」、Biochem J.、2000年3月1日、第346巻、第Pt 2号、p. 447-54

【非特許文献28】ゴールドバーグ (Goldberg) ら、「微生物及び動物細胞におけるATP依存プロテアーゼのメカニズムと機能 (The mechanism and functions of ATP-dependent proteases in bacterial and animal cells)」、Eur J Biochem.、1992年1月15日、第203巻、第1-2号、p. 9-23

【非特許文献29】ゴールドバーグ (Goldberg) ら、「タンパク質分解、プロテオソームと抗原表現 (Proteolysis, proteasomes and antigen presentation)」、ネイチャー誌 (Nature)、1992年6月4日、第357巻、第6377号、375-9

【非特許文献30】イクバル (Iqbal) ら、「プロテアソームの強力な阻害剤 (Potent inhibitors of proteasome)」, J Med Chem., 1995年6月23日、第38巻、第13号、p. 2276-7

【非特許文献31】イクバル (Iqbal) ら、「強力な α -ケトカルボニル及びボロン酸エステル誘導プロテアソーム阻害剤 (Potent α -Ketocarboxyl And Boronic Ester Derived Inhibitors Of Proteasome)」, Med. Chem. Lett., 1996年、第6巻、p. 287-290

【非特許文献32】ケトナー (Kettner) ら、「ペプチドボロン酸によるセリンプロテアーゼ白血球エラスターゼ、カテプシンG、及びキモトリプシンの阻害 (Inhibition of the serine proteases leukocyte elastase, pancreatic elastase, cathepsin G, and chymotrypsin by peptide boronic acids.)」, J Biol Chem., 1984年12月25日、第259巻、第24号、p. 15106-14

【非特許文献33】キセレブ (Kisseliev) ら、「プロテアソーム阻害剤：研究ツールから薬剤候補物質まで (Proteasome inhibitors: from research tools to drug candidates)」, Chem Biol., 2001年、第8巻、第8号、p. 739-58

【非特許文献34】リー (Li) ら、「新規なプロテアソーム内因性阻害剤の単離と解析 (Isolation and characterization of a novel endogenous inhibitor of the proteasome)」, Biochemistry, 1991年10月8日、第30巻、第40号、p. 9709-15

【非特許文献35】マテソン (Matteson) ら、「ピナジオールボロン酸エステルを経由した99%キラル選択的合成：昆虫フェロモン、ジオール、及びアミノアルコール (99% Chirally Selective Synthesis Via Pinanediol Boronic Esters; Insect Pheromones, Diols, And An Amino Alcohol)」, J. Am. chem. Soc., 1986年、108巻、p. 810-819

【非特許文献36】ムラカミ (Murakami) ら、「非リソソームの高分子量プロテアーゼ及びカルシウム依存プロテアーゼの内因性阻害剤 (Endogenous inhibitor of nonlysosomal high molecular weight protease and calcium-dependent protease)」, Proc Natl Acad Sci., 1986年10月、第83巻、第20号、p. 7588-92

【非特許文献37】ケムグーニジンケング (Nkemgu-Njinkeng) ら、「プロテアソーム阻害剤の抗トリパノソーマ薬活性 (Antitrypanosomal Activities Of Proteasome Inhibitors)」, Antimicrob. Agents Chemother., 2002年6月、第46巻、第6号、p. 2038-40

【非特許文献38】オルロウスキ (Orlowski) ら、「多触媒性プロテイナーゼ複合体、主要なリソソーム外タンパク質分解系 (The multicatalytic proteinase complex, a major extralysosomal proteolytic system)」, Biochemistry, 1990年11月13日、第29巻、第45号、p. 10289-97

【非特許文献39】プランデア (Purandare) ら、「強力且つ迅速な可逆的20S-プロテアソーム阻害剤の同定 (Identification Of A Potent And Rapidly Reversible Inhibitor Of The 20S-Proteasome)」, Bioorganic & Medicinal

l Chemistry Letters、2004年、p. 1-4

【非特許文献40】リベット (Rivett) ら、「哺乳類細胞の多触媒的プロテイナーゼ (The multicatalytic proteinase of mammalian cells)」、Arch Biochem Biophys.、1989年1月、第268巻、第1号、p. 1-8

【非特許文献41】リベット (Rivett) ら、「多触媒的プロテイナーゼ 複合タンパク質分解活性 (The multicatalytic proteinase. Multiple proteolytic activities)」、J Biol Chem.、1989年7月25日、第264巻、第21号、p. 12215-9

【非特許文献42】ロック (Rock) ら、「プロテアソーム阻害剤による細胞タンパク質分解の阻害、及びクラスIMHC分子におけるペプチド生成の阻害 (Inhibitors of the proteasome block the degradation of most cell proteins and the generation of peptides presented on MHC class I molecules)」、Cell.、1994年9月9日、第78巻、第5号、p. 761-71

【非特許文献43】タナカ (Tanaka) ら、「プロテアソーム：タンパク質及び遺伝子構造 (Proteasomes: protein and gene structures)」、New Biol.、1992年、第4巻、第3号、p. 173-187

【非特許文献44】ツブキ (Tsubuki) ら、「神経形成を調整するZ-Leu-Leu-Leu-MCA分解プロテアーゼの精製と解析：プロテアソームの新規な触媒活性 (Purification and characterization of a Z-Leu-Leu-Leu-MCA degrading protease expected to regulate neurite formation: a novel catalytic activity in proteasome)」、biochem Biophys Res Commun.、1993年11月15日、第196巻、第3号：p. 1195-201

【非特許文献45】ヴィニスキー (Vinitsky) ら、「垂体多触媒プロテイナーゼ複合体のキモトリプシン様活性の阻害 (Inhibition of the chymotrypsin-like activity of the pituitary multicatalytic proteinase complex)」、Biochemistry、1992年10月6日、第31巻、第39号、p. 9421-8

【非特許文献46】ウー (Wu) ら、「プロテアソーム阻害剤による活性剤の活性酸素種の生成を解したタンパク質1経路刺激 (Proteasome Inhibitors Stimulate Activator Protein-1 Pathway Via Reactive Oxygen Species Production)」、F EBS Letters、2002年、第526巻、第1号、p. 101-105

【非特許文献47】ゼムボーワ (Zembower) ら、「セリンプロテイナーゼの親和性クロマトグラフィーに対する多様な合成リガンド (Versatile Synthetic Ligands For Affinity Chromatography Of Serine Proteinases)」、Int'l J. Of Peptide & Protein Research、1996年、第47巻、第5号、p. 405-413

【非特許文献48】シモブ、ビルジャナ ペリック (Simov, Biljana Peric) ら、「キラルなカルバンイオン、パート4：(トリメチルシリル)メチル N, N-ジアルキルカルバメートのボリル化-ジアスレオ選択性及び構造研究 (Chiral Carbanions, Part 4: Borylation of (Trimethylsilyl)methyl N, N-Dialkylcarbamates -Diastereoselectivity and Structural Studies)」、Synthesis、2004年、第16号、p. 2704-2710