

【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18年11月16日(2006.11.16)

【公表番号】特表2006-503862(P2006-503862A)

【公表日】平成18年2月2日(2006.2.2)

【年通号数】公開・登録公報2006-005

【出願番号】特願2004-541383(P2004-541383)

【国際特許分類】

C 0 7 D 223/16 (2006.01)
A 6 1 K 31/55 (2006.01)
A 6 1 K 31/553 (2006.01)
A 6 1 K 31/554 (2006.01)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
C 0 7 D 267/10 (2006.01)
C 0 7 D 267/14 (2006.01)
C 0 7 D 281/06 (2006.01)
C 0 7 D 281/10 (2006.01)
C 0 7 D 417/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 223/16 A
A 6 1 K 31/55
A 6 1 K 31/553
A 6 1 K 31/554
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 43/00 1 1 1
C 0 7 D 267/10
C 0 7 D 267/14
C 0 7 D 281/06
C 0 7 D 281/10 C S P
C 0 7 D 417/04

【手続補正書】

【提出日】平成18年9月29日(2006.9.29)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

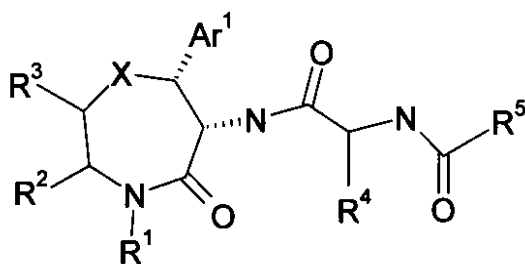
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)

【化1】



(I)

[式中、XはC、O、NR¹、SO₂またはSであり；

Ar¹は場合により0、1、2または3個のR^e部分で置換される5 - または6 - 員の芳香環または複素環であり、該環は0、1、2または3個の窒素、酸素または硫黄原子を有するが、酸素原子は2個よりまたは硫黄原子は2個より多くはないか、または酸素原子1個および硫黄原子1個であり；

R¹はH、C₁₋₃アルキルC₃₋₆シクロアルキル、C₁₋₆アルキル、C₃₋₆アルケニル、C₃₋₆アルキニルC₃₋₆シクロアルキル、C₂₋₄アルキルNR^aR^b、C₁₋₄アルキルC(=O)R^d、あるいは0、1、2または3個のR^eで置換されるC₁₋₃アルキルフェニルであり；

R^aおよびR^bはそれぞれ独立してH、C₁₋₄アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルから選択され、またはR^aおよびR^bはそれらが結合しているNと一緒に2個の窒素原子を有する5 - もしくは6 - 員のN - 結合複素環を形成し、ここで非結合窒素はR^cまたは1個の窒素および1個の酸素で置換され、環原子には非結合窒素がなく；

R^cはそれぞれ独立してH、C₁₋₃アルキル、または0、1、2もしくは3個のR^eで置換されるフェニルから選択され；

R^dはそれぞれ独立してC₁₋₃アルキル、ヒドロキシ、C₁₋₃アルコキシまたはNR^aR^bから選択され；

R^eはそれぞれ独立してH、OH、F、Cl、Br、I、CN、NO₂、CF₃、C₁₋₆アルキルまたはC₁₋₆アルコキシから選択され；

R²およびR³はそれぞれ独立してH、C₁₋₆アルキル、C₄₋₆シクロアルキル、アリールまたはヘテロアリールから選択され、またはR²およびR³は一緒になって0、1もしくは2個のR^f部分で置換されうる縮合フェニルまたはシクロヘキシル部分を形成し；

R^fはNO₂、F、Cl、Br、I、CF₃、CN、C₁₋₆アルキルまたはC₁₋₆アルコキシであり；

R⁴はH、CHR⁷R⁸、5 - または6 - 員のシクロアルキル、場合により0、1または2個のR^f部分で置換される、5 - もしくは6 - 員の複素環または5 - もしくは6 - 員の芳香環であり、該複素環は0、1、2または3個の窒素、酸素または硫黄原子を有するが、酸素原子は2個よりまたは硫黄原子も2個より多くはないか、または酸素原子1個および硫黄原子1個であり；

R⁵はC₁₋₃アルキルR⁹またはCH(OH)R¹⁰であり；

R⁷およびR⁸はそれぞれ独立してH、C₁₋₄アルキル、OH、SH、CH₂SCH₃、CONH₂、CH₂CONH₂、CO₂H、CH₂CO₂H、(CH₂)₃NHCH(NH₂)₂、C₁₋₄アルキルアミン、インドール、イミダゾール、フェニルまたはヒドロキシフェニルから選択され、またはR⁷およびR⁸は一緒になって場合により0、1もしくは2個のR^f部分で置換される6 - 員の芳香環または複素環を形成し、該複素環は0、1、2または3個の窒素、酸素または硫黄原子を有するが、酸素原子は2個よりまたは硫黄原子は2個より多くはないか、または酸素原子1個および硫黄原子1個であり；

R⁹は0、1、2または3個のR^eで置換されるフェニルであり；

R¹⁰はアルキルまたはR⁹である] の化合物またはその薬学的に許容しうる塩。

【請求項2】

XはC、O、NR¹、SO₂またはSであり；

Ar¹は場合により0、1、2または3個のR^e部分で置換される5-または6-員の芳香環または複素環であり、該環は0、1または2個の窒素、酸素または硫黄原子を有するが、酸素原子は2個より多くはないか、または酸素原子1個および硫黄原子1個であり；

R¹はH、C₁₋₃アルキルC₃₋₆シクロアルキル、C₁₋₆アルキル、C₃₋₆アルケニル、C₃₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、C₂₋₄アルキルNR^aR^b、C₁₋₄アルキルC(=O)R^d；または0、1もしくは2個のR^eで置換されるC₁₋₃アルキルフェニルであり；

R^aおよびR^bはそれぞれ独立してH、C₁₋₄アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルから選択され、またはR^aおよびR^bはそれらが結合しているNと一緒に2個の窒素原子を有する6-員のN-結合複素環を形成し、ここで非結合窒素はR^cまたは1個の窒素および1個の酸素で置換され、環原子には非結合窒素がなく；

R^cはそれぞれ独立してH、C₁₋₃アルキルまたはフェニルから選択され；

R^dはそれぞれ独立してC₁₋₃アルキルまたはNR^aR^bから選択され；

R^eはそれぞれ独立してH、OH、F、Cl、Br、I、CN、NO₂、CF₃、C₁₋₃アルキルまたはC₁₋₃アルコキシから選択され；

R²およびR³はそれぞれ独立してH、C₁₋₆アルキル、C₄₋₆シクロアルキルまたはアリールから選択され、あるいはR²およびR³は一緒になって0、1または2個のR^f部分で置換される縮合フェニル部分を形成し；

R^fはNO₂、F、Cl、Br、I、CF₃、CN、C₁₋₃アルキルまたはC₁₋₃アルコキシであり；

R⁴はH、CHR⁷R⁸、6-員のシクロアルキル、または場合により0、1もしくは2個のR^f部分で置換される、6-員の複素環もしくは6-員の芳香環であり、該複素環は0、1、2または3個の窒素、酸素または硫黄原子を有するが、酸素原子は2個よりまたは硫黄原子は2個より多くはないか、または酸素原子1個および硫黄原子1個であり；

R⁵はC₁₋₃アルキルR⁹またはCH(OH)R¹⁰であり；

R⁷およびR⁸はそれぞれ独立してH、C₁₋₄アルキル、OH、CONH₂、CH₂CONH₂、CO₂H、CH₂CO₂H、(CH₂)₃NHCH(NH₂)₂、C₁₋₄アルキルアミン、インドール、イミダゾール、フェニルまたはヒドロキシフェニルから選択され、またはR⁷およびR⁸は一緒になって場合により0、1または2個のR^f部分で置換される6-員の芳香環または複素環を形成し、該複素環は0、1、2または3個の窒素、酸素または硫黄原子を有するが、酸素原子は2個よりまたは硫黄原子は2個より多くはないか、または酸素原子1個および硫黄原子1個であり；

R⁹は0、1または2個のR^eで置換されるフェニルであり；

R¹⁰はアルキルまたはR⁹である、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

XはC、O、NR¹、SO₂またはSであり；

Ar¹は場合により0、1、2または3個のR^e部分で置換される5-または6-員の芳香環または複素環であり、該環は0、1または2個の窒素、酸素または硫黄原子を有するが、酸素原子は2個より多くはないか、または酸素原子1個および硫黄原子1個であり；

R¹はH、C₁₋₃アルキルC₃₋₆シクロアルキル、C₁₋₆アルキル、C₃₋₆アルケニル、C₃₋₆アルキニルC₃₋₆シクロアルキル、C₂₋₄アルキルNR^aR^b、C₁₋₄アルキルC(=O)R^d；または0、1もしくは2個のR^eで置換されるC₁₋₃アルキルフェニルであり；

R^aおよびR^bはそれぞれ独立してH、C₁₋₄アルキルまたはC₃₋₆シクロアルキルから選択され、またはR^aおよびR^bはそれらが結合しているNと一緒に2個の窒素原子を有する5-員のN-結合複素環を形成し、ここで非結合窒素はR^cまたは1個の窒素および1個の酸素で置換され、環原子には非結合窒素がなく；

R^cはそれぞれ独立してH、C₁₋₃アルキル、フェニルから選択され；

R^dはそれぞれ独立してC₁₋₃アルキルまたはNR^aR^bから選択され；

R^eはそれぞれ独立してH、OH、F、Cl、Br、I、CN、NO₂、CF₃、C₁₋₆アルキルまたはC₁₋₆アルコキシから選択され；

R²およびR³はそれぞれ独立してH、C₁₋₆アルキル、C₄₋₆シクロアルキルまたはアリールから選択され、またはR²およびR³は一緒になって0、1または2個のR^f部分で置換される縮合フェニル部分を形成し；

R^f は H、 NO_2 、F、Cl、Br、I、 CF_3 、 C_{1-6} アルキルまたは C_{1-6} アルコキシであり；

R^4 は H、 CHR^7R^8 、または場合により 0、1 もしくは 2 個の R^f 部分で置換される、6 - 員の複素環もしくは 6 - 員の芳香族環であり、該複素環は 0、1、2 または 3 個の窒素、酸素または硫黄原子を有するが、酸素原子は 2 個よりまたは硫黄原子は 2 個より多くはないか、または酸素原子 1 個および硫黄原子 1 個であり；

R^4 は H または CHR^7R^8 であり；

R^5 は C_{1-3} アルキル R^9 または $\text{CH}(\text{OH})\text{R}^{10}$ であり；

n は 0、1 または 2 であり；

R^7 および R^8 はそれぞれ独立して H、 C_{1-4} アルキル、OH、 CONH_2 、 CH_2CONH_2 、 CO_2H 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{NHCH}(\text{NH}_2)_2$ 、 C_{1-4} アルキルアミン、インドール、イミダゾール、フェニルまたはヒドロキシフェニルから選択され、または R^7 および R^8 は一緒になって場合により 0、1 または 2 個の R^f 部分で置換される 6 - 員の芳香環または複素環を形成し、該複素環は 0、1 または 2 個の窒素、酸素または硫黄原子を有し；

R^9 は 1 または 2 個の R^e で置換されるフェニルであり；

R^{10} は 1 または 2 個の R^e で置換されるアルキルまたはフェニルである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】

X は C、O、 NR^1 、 SO_2 または S であり；

Ar^1 は場合により 0、1、2 または 3 個の R^e 部分で置換される 5 - または 6 - 員の芳香環または複素環であり、該環は 0、1 または 2 個の窒素、酸素または硫黄原子を有するが、酸素原子 1 個および硫黄原子 1 個より多くなく；

R^1 は H、 C_{1-3} アルキル C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-6} アルキニル C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキル NR^aR^b 、 C_{1-4} アルキル $\text{C}(=\text{O})\text{R}^d$ ；または 0 もしくは 1 個の R^e で置換される C_{1-3} アルキルフェニルであり；

R^a および R^b はそれぞれ独立して H、 C_{1-4} アルキルまたは C_{5-6} シクロアルキルから選択され、または R^a および R^b はそれらが結合している N と一緒になって 2 個の窒素原子を有する 6 - 員の N - 結合複素環を形成し、ここで非結合窒素は R^c または 1 個の窒素および 1 個の酸素で置換され、環原子には非結合窒素がなく；

R^c はそれぞれ独立して H、 C_{1-3} アルキルから選択され；

R^d はそれぞれ独立して C_{1-3} アルキルから選択され；

R^e はそれぞれ独立して H、OH、F、Cl、Br、I、CN、 NO_2 、 CF_3 、 C_{1-6} アルキルから選択され；

R^2 および R^3 はそれぞれ独立して H、 C_{1-6} アルキルから選択され、または R^2 および R^3 は一緒になって 0、1 または 2 個の R^f 部分で置換されうる縮合フェニル部分を形成し；

R^f は H、F、Cl、Br、I、 CF_3 、 C_{1-6} アルキルであり；

R^4 は H、 CHR^7R^8 、または場合により 0、1 もしくは 2 個の R^f 部分で置換される、6 - 員の複素環もしくは 6 - 員の芳香環であり、該複素環は 0、1 または 2 個の窒素、酸素または硫黄原子を有し；

R^5 は C_{1-3} アルキル R^9 または $\text{CH}(\text{OH})\text{R}^{10}$ であり；

n は 0、1 または 2 であり；

R^7 および R^8 はそれぞれ独立して H、 C_{1-4} アルキル、OH、 CONH_2 、 CH_2CONH_2 、 CO_2H 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $(\text{CH}_2)_3\text{NHCH}(\text{NH}_2)_2$ 、 C_{1-4} アルキルアミン、インドール、イミダゾール、フェニルまたはヒドロキシフェニルから選択され、または R^7 および R^8 は一緒になって場合により 0、1 または 2 個の R^f 部分で置換される 6 - 員の芳香環または複素環を形成し、該複素環は 0、1 または 2 個の窒素または酸素原子を有し；

R^9 は 1 または 2 個の R^e で置換されるフェニルであり；

R^{10} はアルキルまたは R^9 である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 5】

X は C、O、 SO_2 または S であり；

Ar^1 は場合により 0、1 または 2 個の R^e 部分で置換される 5 - または 6 - 員の芳香環ま

たは複素環であり、該環は0、1または2個の窒素、酸素または硫黄原子を有し；

R^1 はH、 C_{1-3} アルキル C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-6} アルキニル C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキル NR^aR^b 、 C_{1-4} アルキル $C(=O)R^d$ であり；

R^a および R^b はそれぞれ独立してH、 C_{1-4} アルキルまたは C_{5-6} シクロアルキルから選択され、または R^a および R^b はそれらが結合しているNと一緒に2個の窒素原子を有する6-員のN-結合複素環を形成し、ここで非結合窒素は R^c または1個の窒素および1個の酸素で置換され、環原子には非結合窒素がなく；

R^d はそれぞれ独立して C_{1-3} アルキルから選択され；

R^e はそれぞれ独立してH、OH、F、Cl、Br、I、 NO_2 、 CF_3 または C_{1-6} アルキルから選択され；

R^2 および R^3 はそれぞれ独立して C_{1-6} アルキルから選択され、または R^2 および R^3 は一緒になって0、1または2個の R^f 部分で置換されうる縮合フェニル部分を形成し；

R^f はH、F、Cl、Br、I、 CF_3 であり；

R^4 はH、 CHR^7R^8 、または場合により0、1もしくは2個の R^f 部分で置換される、6-員の複素環もしくは6-員の芳香環であり、該複素環は0、1または2個の窒素または酸素原子を有し；

R^5 は C_{1-3} アルキル R^9 または $CH(OH)R^{10}$ であり；

R^7 および R^8 はそれぞれ独立してH、 C_{1-4} アルキル、OH、 $CONH_2$ 、 CH_2CONH_2 、 CO_2H 、 C_{1-4} アルキルアミン、フェニルまたはヒドロキシフェニルから選択され、または R^7 および R^8 は一緒になって場合により0、1または2個の R^f 部分で置換される6-員の芳香環または複素環を形成し、該複素環は0、1または2個の窒素または酸素原子を有し；

R^9 は1または2個の R^e で置換されるフェニルであり；

R^{10} はアルキルまたは R^9 である、請求項1記載の化合物。

【請求項6】

XはC、O、 SO_2 またはSであり；

Ar^1 は場合により0、1または2個の R^e 部分で置換される6-員の芳香環または複素環であり、該環は0または1個の窒素、酸素または硫黄原子を有し；

R^1 はH、 C_{1-3} アルキル C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-6} アルキニル C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキル NR^aR^b 、 C_{1-4} アルキル $C(=O)R^d$ であり；

R^a および R^b はそれぞれ独立してH、 C_{1-4} アルキルまたは C_{5-6} シクロアルキルから選択され、または R^a および R^b はそれらが結合しているNと一緒に1個の窒素および1個の酸素を有する6-員のN-結合複素環を形成し、環原子には非結合窒素がなく；

R^d はそれぞれ独立して C_{1-3} アルキルから選択され；

R^e はそれぞれ独立してH、OH、F、Cl、Br、I、 CF_3 から選択され；

R^2 および R^3 は一緒になって0、1または2個の R^f 部分で置換される縮合フェニル部分を形成し；

R^f はH、F、Cl、Br、Iまたは CF_3 であり；

R^4 はH、 CHR^7R^8 、または場合により0、1もしくは2個の R^f 部分で置換される、6-員の複素環もしくは6-員の芳香環であり、該複素環は0または1個の窒素または酸素原子を有し；

R^5 は C_{1-3} アルキル R^9 または $CH(OH)R^{10}$ であり；

R^7 および R^8 はそれぞれ独立してH、OHから選択され、または R^7 および R^8 は一緒になって場合により0、1または2個の R^f 部分で置換される6-員の芳香環または複素環を形成し、該複素環は0または1個の窒素または酸素原子を有し；

R^9 は2個の R^e で置換されるフェニルであり；

R^{10} は2個の R^e で置換されるフェニルである、請求項1記載の化合物。

【請求項7】

XはC、OまたはSであり；

Ar^1 は場合により0、1または2個の R^e 部分で置換される6-員の芳香環または複素環であり、該環は0または1個の窒素または酸素原子を有し；

R^1 は H、 C_{1-3} アルキル C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-6} アルキニル C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキル $NR^a R^b$ であり；

R^a および R^b はそれぞれ独立して H、 C_{1-4} アルキルまたは C_{5-6} シクロアルキルから選択され、または R^a および R^b はそれらが結合している N と一緒になって 1 個の窒素および 1 個の酸素を有する 6 - 員の N - 結合複素環を形成し、環原子には非結合窒素がなく；

R^2 および R^3 は一緒になって 0、1 または 2 個の R^f で置換される縮合フェニル部分を形成し；

R^e はそれぞれ独立して H、OH、F、Cl、Br、I、 CF_3 から選択され；

R^f は F または Cl であり；

R^4 は H、 $CHR^7 R^8$ 、または場合により 0、1 もしくは 2 個の R^f 部分で置換される 6 - 員の芳香環であり；

R^5 は C_{1-3} アルキル R^9 または $CH(OH)R^{10}$ であり；

R^7 および R^8 はそれぞれ独立して H、OH から選択され、または R^7 および R^8 は一緒になって場合により 0、1 または 2 個の R^f 部分で置換される 6 - 員の芳香環を形成し；

R^7 および R^8 はそれぞれ独立して H または OH から選択され；

R^9 は 2 個の R^e で置換されるフェニルであり；

R^{10} は 2 個の R^e で置換されるフェニルである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 8】

X は O、C または S であり；

Ar^1 は場合により 0、1 または 2 個の R^e 部分で置換される 6 - 員の芳香環または複素環であり、該環は 0 または 1 個の窒素原子を有し；

R^1 は H、 C_{1-3} アルキル C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-6} アルキニル C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキル $NR^a R^b$ であり；

R^a および R^b はそれぞれ独立して H、 C_{1-4} アルキルまたは C_{5-6} シクロアルキルから選択され、または R^a および R^b はそれらが結合している N と一緒になって 1 個の窒素および 1 個の酸素を有する 6 - 員の N - 結合複素環を形成し、環原子には非結合窒素がなく；

R^2 および R^3 は一緒になって 0、1 または 2 個の R^f で置換される縮合フェニル部分を形成し、ここで R^f は F または Cl であり；

R^4 は H、 CH_3 、または場合により 0、1 または 2 個の R^f 部分で置換される 6 - 員の芳香環であり；

R^5 は C_{1-3} アルキル R^9 であり；

R^e はそれぞれ独立して H、OH、F、Cl、Br、I、 CF_3 から選択され；

R^9 は 2 個の R^e で置換されるフェニルである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 9】

X は O または C であり；

Ar^1 は場合により 0、1 または 2 個の R^e 部分で置換される 6 - 員の芳香環であり；

R^1 は H、 C_{1-3} アルキル C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-6} アルキニル C_{3-6} シクロアルキル、 C_{2-4} アルキル $NR^a R^b$ であり；

R^a および R^b はそれぞれ独立して H、 C_{1-4} アルキルまたは C_{5-6} シクロアルキルから選択され、または R^a および R^b はそれらが結合している N と一緒になって 1 個の窒素および 1 個の酸素を有する 6 - 員の n - 結合複素環を形成し、環原子には非結合窒素がなく；

R^2 および R^3 は一緒になって 0、1 または 2 個の R^f で置換される縮合フェニル部分を形成し、ここで R^f は F または Cl であり；

R^4 は H、 CH_3 、または場合により 0、1 または 2 個の R^f 部分で置換される 6 - 員の芳香環であり；

R^5 は C_{1-3} アルキル R^9 であり；

R^e はそれぞれ独立して H、OH、F、Cl、Br、I、 CF_3 から選択され；

R^9 は 2 個の R^e で置換されるフェニルである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 10】

X は O であり；

Ar^1 は場合により0、1または2個の R^e 部分で置換される6-員の芳香環であり；

R^1 は C_{1-3} アルキル C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-6} アルキニルであり；

R^2 および R^3 は一緒になって0、1または2個の R^f で置換される縮合フェニル部分を形成し、ここで R^f はFまたはClであり；

R^4 はH、 CH_3 、または場合により0、1もしくは2個の R^f 部分で置換される6-員の芳香環であり；

R^5 は C_{1-3} アルキル R^g であり；

R^e はそれぞれ独立してH、OH、F、Cl、Br、I、 CF_3 から選択され；

R^g は2個の R^e で置換されるフェニルである、請求項1記載の化合物。

【請求項11】

XはC、O、 SO_2 またはSである、請求項1記載の化合物。

【請求項12】

Ar^1 は場合により0または1個の R^e で置換される5-もしくは6-員の芳香環または複素環である、請求項1記載の化合物。

【請求項13】

R^1 は C_{1-3} アルキル C_{3-6} シクロアルキル、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-6} アルケニル、 C_{3-6} アルキニルである、請求項1記載の化合物。

【請求項14】

R^a および R^b はそれぞれ独立してH、 C_{1-4} アルキルまたは C_{5-6} シクロアルキルから選択され、または R^a および R^b はそれらが結合しているNと一緒に1個の窒素および1個の酸素を有する6-員のN-結合複素環を形成し、環原子には非結合窒素がない、請求項1記載の化合物。

【請求項15】

R^2 および R^3 は一緒になって0、1または2個の R^f で置換される縮合フェニル部分を形成する、請求項1記載の化合物。

【請求項16】

R^e はそれぞれ独立してFまたはClから選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項17】

R^f はFまたはClである、請求項1記載の化合物。

【請求項18】

R^4 はH、 CHR^7R^8 、または場合により0、1もしくは2個の R^f 部分で置換される6-員の芳香環であり、 R^7 および R^8 はそれぞれ独立してHまたはOHから選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項19】

R^4 は場合により0、1または2個の R^f 部分で置換される6-員の芳香環であり、 R^f はハロである、請求項1記載の化合物。

【請求項20】

R^5 は C_{1-3} アルキル R^g または $CH(OH)R^{10}$ である、請求項1記載の化合物。

【請求項21】

R^7 および R^8 はそれぞれ独立してHまたはOHから選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項22】

R^g は2個の R^e で置換されるフェニルである、請求項1記載の化合物。

【請求項23】

R^{10} は2個の R^e で置換されるフェニルである、請求項1記載の化合物。

【請求項24】

N^2 - [(3,5-ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3R) - 2 - (2,5-ジフルオロフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5-テトラヒドロ - 1,5-ベンゾチアゼピン - 3-イル] - L-アラニンアミド；

N^1 - [(2R,3R) - 5-シクロヘキシル - 2 - (2,5-ジフルオロフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,

4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N¹ - {(2R,3R) - 2 - (2,5 - ジフルオロフェニル) - 5 - [2 - (ジメチルアミノ)エチル] - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル} - L - アラニンアミド ;

N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N¹ - [(2R,3R) - 2 - (2,5 - ジフルオロフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - セリンアミド ;

N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N¹ - [(2R,3R) - 2 - (2,5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N¹ - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N¹ - [(6R,7R) - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - チアゼパン - 6 - イル] - L - アラニンアミド ;

N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N¹ - [(3S,4R) - 8 - フルオロ - 2 - オキソ - 4 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1H - 1 - ベンズアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N¹ - [(2R,3R) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N¹ - [(2R,3R) - 2 - (3,4 - ジクロロフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N¹ - [(2R,3R) - 2 - (4 - クロロフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N¹ - [(2R,3R) - 2 - (4 - メチルフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N¹ - [(2R,3R) - 7 - クロロ - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N¹ - {(2R,3R) - 7 - クロロ - 5 - [2 - (ジメチルアミノ)エチル] - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル} - N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N¹ - [(2R,3R) - 2 - (3 - クロロフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N¹ - [(2R,3R) - 2 - (3,5 - ジフルオロフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N¹ - [(2R,3R) - 2 - (3,5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N¹ - [(2R,3R) - 2 - (2 - フルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N¹ - {(2R,3R) - 2 - (3 - クロロフェニル) - 5 - [2 - (ジメチルアミノ)エチル] - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル} - N² - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3R) - 2 - (2,5 - ジフルオロフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - D - セリンアミド ;

N^1 - [(2R,3R) - 2 - (3 - クロロフェニル) - 5 - メチル - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3R) - 5 - メチル - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^1 - [(2R,3R) - 5 - シクロヘキシル - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N^1 - [(2R,3R) - 7 - クロロ - 5 - シクロヘキシル - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(6R,7R) - 7 - (1 - ナフチル) - 5 - オキソ - 1,4 - チアゼパン - 6 - イル] - L - アラニンアミド ;

(2S) - 2 - { [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル]アミノ } - N - [(6R,7R) - 7 - (1 - ナフチル) - 5 - オキソ - 1,4 - チアゼパン - 6 - イル] - 2 - フェニルアセトアミド ;

(2S) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチル - N - ((1S) - 2 - { [(6R,7R) - 7 - (1 - ナフチル) - 5 - オキソ - 1,4 - チアゼパン - 6 - イル]アミノ } - 2 - オキソ - 1 - フェニルエチル)ペンタンアミド ;

(2S) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチル - N - ((1S) - 2 - オキソ - 2 - { [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル]アミノ } - 1 - フェニルエチル)ペンタンアミド ;

N^2 - [(2S) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタノイル] - N^1 - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - ロイシンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(6S,7R) - 4 - メチル - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - オキシアゼパン - 6 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2S,6S,7R) - 4 - メチル - 5 - オキソ - 2,7 - ジフェニル - 1,4 - オキシアゼパン - 6 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(6R,7R) - 4 - メチル - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - チアゼパン - 6 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(3R,6S,7R) - 4 - メチル - 5 - オキソ - 3,7 - ジフェニル - 1,4 - オキシアゼパン - 6 - イル] - L - アラニンアミド ;

(2S) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチル - N - ((1S) - 2 - { [(6S,7R) - 4 - メチル - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - オキシアゼパン - 6 - イル]アミノ } - 2 - オキソ - 1 - フェニルエチル)ペンタンアミド ;

(2S) - 2 - { [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル]アミノ } - N - [(6S,7R) - 4 - メチル - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - オキシアゼパン - 6 - イル] - 2 - フェニルアセトアミド ;

(2S) - 2 - シクロヘキシル - 2 - { [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル]アミノ } - N - [(3R,6S,7R) - 4 - メチル - 5 - オキソ - 3,7 - ジフェニル - 1,4 - オキシアゼパン - 6 - イル]アセトアミド ;

(2S) - 2 - { [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル]アミノ } - N - [(3R,6S,7R) - 4 - メチル - 5 - オキソ - 3,7 - ジフェニル - 1,4 - オキシアゼパン - 6 - イル] - 2 - フェニルアセトアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(6S,7R) - 4 - (4 - メトキシベンジル) - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - オキシアゼパン - 6 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3S,5aR,9aR) - 5 - メチル - 4 - オキソ - 2 - フェニルデカヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

(2S) - 2 - { [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル]アミノ } - N - [(6S,7R) - 4 - (4 - メトキシベンジル) - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - オキシアゼパン - 6 - イル] - 2 - フェニルアセトアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3R) - 2 - (4 - メトキシフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^1 - [(2R,3R) - 7 - クロロ - 2 - (2,5 - ジフルオロフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(2S) - 2 - (3,5 - ジフルオロフェニル) - 2 - ヒドロキシアセチル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(2S) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチル - 1 - オキソペンチル] - N^1 - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3S) - 5 - メチル - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^1 - [(2R,3R) - 7 - クロロ - 2 - (2,5 - ジフルオロフェニル) - 5 - メチル - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - { (2R,3S) - 5 - [2 - (ジメチルアミノ)エチル] - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル } - L - アラニンアミド ;

N^1 - [(2R,3R) - 7 - クロロ - 2 - (2,5 - ジフルオロフェニル) - 4 - オキソ - 5 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(6R,7R) - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - チアゼパン - 6 - イル] - L - フェニルアラニンアミド ;

N^2 - [(2S) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタノイル] - N^1 - [(6R,7R) - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - チアゼパン - 6 - イル] - L - フェニルアラニンアミド ;

(2S) - 2 - { [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル]アミノ } - N - [(6R,7R) - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - チアゼパン - 6 - イル] - 2 - フェニルアセトアミド ;

(2S) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチル - N - ((1S) - 2 - オキソ - 2 - { [(6R,7R) - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - チアゼパン - 6 - イル]アミノ } - 1 - フェニルエチル)ペンタンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(6R,7R) - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - チアゼパン - 6 - イル] - L - ロイシンアミド ;

N^2 - [(2S) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタノイル] - N^1 - [(6R,7R) - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - チアゼパン - 6 - イル] - L - ロイシンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(6R,7R) - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - チアゼパン - 6 - イル] - L - バリンアミド ;

N^2 - [(2S) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタノイル] - N^1 - [(6R,7R) - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - チアゼパン - 6 - イル] - L - バリンアミド ;

N^1 - [(2R,3S) - 7 - クロロ - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

(2S) - N - ((1S) - 2 - { [(2R,3S) - 7 - クロロ - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル]アミノ } - 2 - オキソ - 1 - フェニルエチル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタンアミド ;

(2S) - 2 - { [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル]アミノ } - N - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - 2 - フェニルアセトアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - セリンアミド ;

(2S) - 2 - シクロヘキシル - 2 - { [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル]アミノ } - N - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル]アセトアミド ;

(2S) - N - ((1S) - 1 - シクロヘキシル - 2 - オキソ - 2 - { [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル]アミノ } エチル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタンアミド ;

3 - シクロヘキシル - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(6R,7R) - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - チアゼパン - 6 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3S) - 5 - (2 - モルホリン - 4 - イルエチル) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - ロイシンアミド ;

(2S) - 2 - { [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル]アミノ } - 2 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル]アセトアミド ;

(2S) - 2 - [(シクロヘキシルアセチル)アミノ] - 2 - (4 - フルオロフェニル) - N - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル]アセトアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 5 - プロパ - 2 - イン - 1 - イル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3S) - 7 - メトキシ - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3S) - 5 - イソプロピル - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

メチル [(2R,3S) - 3 - ({ N - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニル } アミノ) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 3,4 - ジヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 5(2H) - イル]アセテート ;

[(2R,3S) - 3 - ({ N - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニル } アミノ) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 3,4 - ジヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 5(2H) - イル]酢酸 ;

N^1 - [(2R,3S) - 5 - (シクロプロピルメチル) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N^1 - [(2R,3S) - 5 - (シクロプロピルメチル) - 7 - メトキシ - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N^1 - [(2R,3S) - 5 - (2 - アゼチジン - 1 - イル - 2 - オキソエチル) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3S) - 7 - フルオロ - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - アラ

ニンアミド ;

(2S) - N - ((1S) - 2 - { [(2R,3S) - 7 - フルオロ - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル]アミノ } - 2 - オキソ - 1 - フェニルエチル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタンアミド ;

N^2 - [(2R) - 2 - (3,5 - ジフルオロフェニル) - 2 - ヒドロキシアセチル] - N^1 - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(2S) - 2 - (3,5 - ジフルオロフェニル) - 2 - ヒドロキシアセチル] - N^1 - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(3S,4R) - 2 - オキソ - 4 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1H - 1 - ベンズアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(3S,4R) - 8 - フルオロ - 1 - メチル - 2 - オキソ - 4 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1H - 1 - ベンズアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

(2S) - N - ((1S) - 2 - { [(3S,4R) - 8 - フルオロ - 2 - オキソ - 4 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1H - 1 - ベンズアゼピン - 3 - イル]アミノ } - 2 - オキソ - 1 - フェニルエチル) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチルペンタンアミド ;

(2S) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチル - N - ((1S) - 2 - オキソ - 2 - { [(3S,4R) - 2 - オキソ - 4 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1H - 1 - ベンズアゼピン - 3 - イル]アミノ } - 1 - フェニルエチル)ペンタンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(3S,4R) - 2 - オキソ - 4 - フェニル - 1 - プロパ - 2 - イン - 1 - イル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1H - 1 - ベンズアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^1 - [(3S,4R) - 1 - (シクロプロピルメチル) - 2 - オキソ - 4 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1H - 1 - ベンズアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(3S,4R) - 1 - イソプロピル - 2 - オキソ - 4 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1H - 1 - ベンズアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(2S) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチル - 1 - オキソペンチル] - N^1 - [(2R,3R) - 2 - (4 - メトキシフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^1 - [(2R,3R) - 2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(2S) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチル - 1 - オキソペンチル] - L - アラニンアミド ;

N^1 - [(2R,3R) - 2 - (2 - クロロフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N^1 - [(2R,3R) - 7 - クロロ - 5 - メチル - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3R) - 2 - (2 - フルオロフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3R) - 2 - (4 - フルオロフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^1 - [(2R,3R) - 7 - クロロ - 2 - (2,5 - ジフルオロフェニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセ

チル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(2S) - 2 - ヒドロキシ - 4 - メチル - 1 - オキソベンチル] - N^1 - [(6R,7R) - 5 - オキソ - 7 - フェニル - 1,4 - チアゼパン - 6 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2S,3R) - 2 - (3 - メチル - 2 - チエニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2S,3R) - 2 - (4 - メチル - 2 - チエニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

メチル5 - [(2S,3R) - 3 - ({ N - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニル } アミノ) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 2 - イル]チオフェン - 3 - カルボキシレート ;

N^1 - [(2R,3R) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N^2 - (フェニルアセチル) - L - アラニンアミド ;

N^1 - [(2R,3R) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N^2 - (2 - フェニルエチル) - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2S,3R) - 4 - オキソ - 2 - (2 - チエニル) - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3R) - 4 - オキソ - 2 - (3 - チエニル) - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2S,3R) - 2 - (2 - フリル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3R) - 2 - (3 - フリル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^1 - [(2S,3R) - 2 - (5 - プロモ - 2 - チエニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N^1 - [(2S,3R) - 2 - (4 - プロモ - 2 - チエニル) - 4 - オキソ - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド ;

N - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N - [(2R,3R) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - フェニルアラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3R) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル]グリシンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3R) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - バリンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3R) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - ロイシンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3R) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - メチオニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - 3 - (1H - インドール - 2 - イル) - N^1 - [(2R,3R) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3R) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - a - アスパラギン ;

N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3R) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾチアゼピン - 3 - イル] - L - a - グルタミン ;

N^1 - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - N^2 - (フェニルアセチル) - L - アラニンアミド ;
 N^2 - [(2 - フルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;
 N^2 - [(3 - フルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;
 N^2 - [(4 - フルオロフェニル)アセチル] - N^1 - [(2R,3S) - 4 - オキソ - 2 - フェニル - 2,3,4,5 - テトラヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - L - アラニンアミド ;
 N^1 - [(2R,3S,5aS,9aS) - 5 - (シクロプロピルメチル) - 4 - オキソ - 2 - フェニルデカヒドロ - 1,5 - ベンゾキシアゼピン - 3 - イル] - N^2 - [(3,5 - ジフルオロフェニル)アセチル] - L - アラニンアミド

から選択される請求項 1 記載の式 (I) の化合物またはその製薬上許容しうる塩。

【請求項 25】

- アミロイド産生と関係がある疾患、アルツハイマー病またはダウン症候群を治療または予防するための薬剤の製造における、請求項 1 ~ 24 の何れか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 26】

- セクレターゼ活性を阻害する薬剤の製造における、請求項 1 ~ 24 の何れか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 27】

請求項 1 ~ 24 の何れか 1 項に記載の式 (I) の化合物を少なくとも 1 種の製薬上許容しうる担体、希釈剤または賦形剤と一緒に含有する医薬組成物。