

【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1月11日(2007.1.11)

【公表番号】特表2006-511608(P2006-511608A)

【公表日】平成18年4月6日(2006.4.6)

【年通号数】公開・登録公報2006-014

【出願番号】特願2005-502535(P2005-502535)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 401/12 (2006.01)**

**C 0 7 D 401/14 (2006.01)**

**C 0 7 D 403/12 (2006.01)**

**C 0 7 D 413/14 (2006.01)**

**C 0 7 D 417/14 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/454 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/4545 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/5377 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/541 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/553 (2006.01)**

**A 6 1 P 7/02 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 11/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 29/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 31/12 (2006.01)**

**A 6 1 P 35/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 41/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 401/12 C S P

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 413/14

C 0 7 D 417/14

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/541

A 6 1 K 31/553

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 41/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成18年11月16日(2006.11.16)

【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

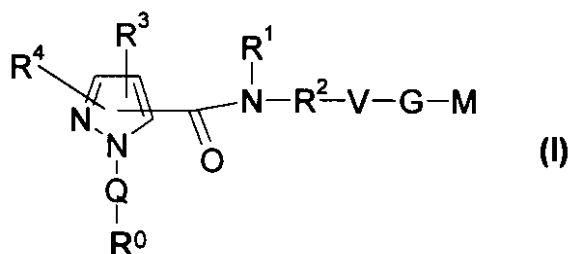
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I

【化1】



の化合物、その全ての立体異性体および該立体異性体のいかなる配合比の混合物、およびその生理学的に忍容性のある塩。

式中、

$R^0$ は、ピリジル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル、フリル、2-フリル、3-フリル；チエニル、2-チエニル、3-チエニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピリダジニルおよびピラジニルからなる群より選択されるヘテロシクリルであって、ここで該ヘテロシクリルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^8$ によりモノ -、ジ - またはトリ置換されており、

そして更に、ピリジル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル、フリル、2-フリル、3-フリル；チエニル、2-チエニル、3-チエニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピリダジニルおよびピラジニルからなる群より選択される残基により置換されており、ここで該残基は非置換であるかまたは互いに独立して $R^8$ によりモノ -、ジ - またはトリ置換されており、

$R^8$ は、

1. F、Cl、Br、I、
  2.  $-C(=O)-NH_2$ 、
  3.  $-(C_1-C_4)$ -アルキル、ここでアルキルは非置換であるかまたは互いに独立してハロゲン、 $-OH$ またはメトキシ残基によりモノ -、ジ - またはトリ置換されている、または
  4.  $-O-(C_1-C_4)$ -アルキル、ここでアルキルは非置換であるかまたは互いに独立してハロゲンまたはメトキシ残基によりモノ -、ジ - またはトリ置換されている、
- であるが、ただし $R^8$ は少なくとも1個のハロゲン、 $-C(=O)-NH_2$ または $-O-(C_1-C_4)$ -アルキル残基であり、

Qは $-(C_1-C_6)$ -アルキレンであり、

$R^1$ は水素原子または $-(C_1-C_2)$ -アルキルであり、

$R^2$ は直接結合または $-(C_1-C_2)$ -アルキレンであり、または

$R^1-N-R^2-V$ は、ピペリジン、ピペラジン、ピリジン、ピリミジン、ピロリジン、ピロリジノン、1,2,3-トリアジン、1,2,4-トリアジン、1,3,5-トリアジン、1,2,3-トリアゾール、1,2,4-トリアゾール、テトラジン、テトラゾール、1,2-ジアゼピン、1,3-ジアゼピン、1,4-ジアゼピン、アゼピン、ケトピペラジン、オキサゾール、イソオキサゾール、イソオキサゾリジン、2-イソオキサゾリン、モルホリン、チアゾール、イソチアゾール、チアジ

アゾールまたはチオモルホリンからなる群より選択される4-~7-員の環式基を形成することができ、ここで該環式基は非置換であるかまたは互いに独立して $R^{14}$ によりモノ -、ジ - またはトリ置換されており、

$R^{14}$ はフッ素、塩素、 $-(C_1-C_4)$ -アルキルまたは $-NH_2$ であり、

Vは、

1. アザインドリル (1H-ピロロピリジル)、アゼチジン、アゼピン、アジリジン、アジリン、1,4-ジアゼパン、1,2-ジアゼピン、1,3-ジアゼピン、1,4-ジアゼピン、ジアジリン、1,3-ジオキサラン、ジオキサゾール、フラン、イミダゾール、イソキノリン、イソチアゾール、イソチアゾリジン、イソチアゾリン、イソオキサゾール、2-イソオキサゾリン、イソオキサゾリジン、ケトピペラジン、モルホリン、1,2-オキサジン、1,3-オキサジン、1,4-オキサジン、オキサゾール、1,2-オキサチオラン、ピペリジン、ピラン、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピペラジン、ピリジン、ピリドン、ピリミジン、ピロール、ピロリジン、ピロリジノン、キナゾリン、キノリン、テトラジン、テトラゾール、チアジアジン、1,2-チアジン、1,3-チアジン、1,4-チアジン、1,3-チアゾール、チエタン、チオモルホリン、チオフエン、チオピラン、1,2,3-トリアジン、1,2,4-トリアジン、1,3,5-トリアジン、1,2,3-トリアゾールまたは1,2,4-トリアゾールから誘導される化合物を含む群より選択される環式残基、

ここで該環式残基は非置換であるかまたは互いに独立して $R^{14}$ によりモノ -、ジ - またはトリ置換されている、または

2. フェニル、ここでフェニルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^{14}$ によりモノ -、ジ - またはトリ置換されている、

Gは直接結合、 $-(CH_2)_m$ -、または $-(CH_2)_m-NR^{10}$ -であり、

mは0、1、2、3または4の整数であり、

Mは、

1. 水素原子、

2. ヘテロシクリル、ここでヘテロシクリルは、1,4-ジアゼパン、ケトモルホリン、チオフエン、ピリダゾン、ピペリジン、ピペラジン、ピリジン、ピリミジン、ピロリジン、ピロリジノン、ピリドニル、イミダゾール、ピリダジン、ピラジン、1,2,3-トリアジン、1,2,4-トリアジン、1,3,5-トリアジン、1,2,3-トリアゾール、1,2,4-トリアゾール、テトラジン、テトラゾール、1,2-ジアゼピン、1,3-ジアゼピン、1,4-ジアゼピン、アゼピン、ケトピペラジン、オキサゾール、イソオキサゾール、イソオキサゾリジン、2-イソオキサゾリン、モルホリン、チアゾール、イソチアゾール、テトラヒドロピラン、1,4,5,6-テトラヒドロ-ピリダジニル、チアジアゾールまたはチオモルホリンから誘導され得る群より選択される残基であり、ここで該ヘテロシクリルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^{14}$ によりモノ -、ジ - またはトリ置換されている、

3.  $-(C_1-C_6)$ -アルキル、ここでアルキルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^{14}$ によりモノ -、ジ - またはトリ置換されている、または

4.  $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、

であり、

$R^3$ および $R^4$ は互いに独立して同じかまたは異なって、そして

1) 水素原子、

2) ハロゲン、

3)  $-(C_1-C_4)$ -アルキル、ここでアルキルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^{13}$ によりモノ -、ジ - またはトリ置換されている、

4)  $-(C_1-C_3)$ -ペルフルオロアルキル、

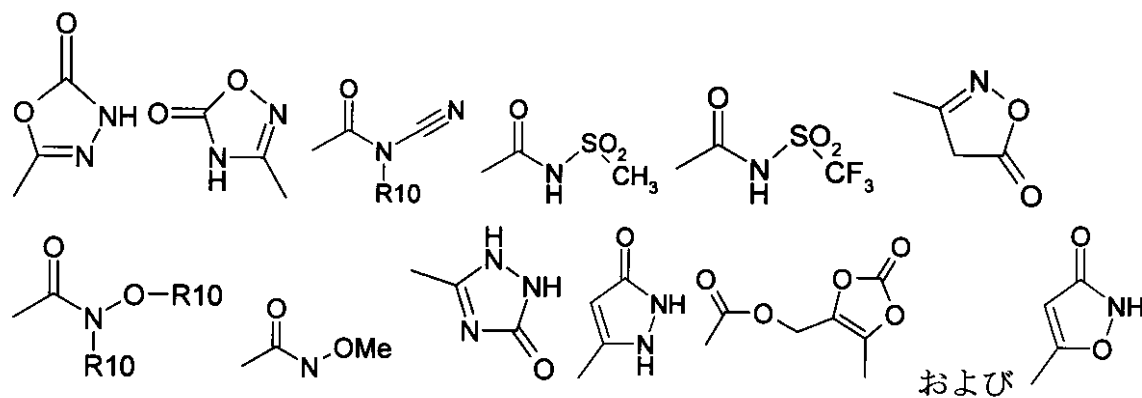
5) フェニル、ここでフェニルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^{13}$ によりモノ -、ジ - またはトリ置換されている、

6)  $-(C_0-C_4)$ -アルキレン-O- $R^{19}$ 、ここで $R^{19}$ は

a) 水素原子、

- b)  $-(C_1-C_4)$ -アルキル、ここでアルキルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^{13}$ によりモノ -、ジ - またはトリ置換されている、または
- c) フェニル、ここでフェニルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^{13}$ によりモノ -、ジ - またはトリ置換されている、
- d)  $-CF_3$ 、または
- e)  $-CHF_2$ 、である、
- 7)  $-CN$ 、
- 8)  $-NR^{10}-SO_2-R^{10}$ 、
- 9)  $-SO_s-R^{11}$ 、ここでsは1または2である
- 10)  $-SO_t-N(R^{11})-R^{12}$ 、ここでtは1または2である、
- 11)  $-(C_0-C_4)$ -アルキレン- $C(O)-R^{11}$ 、
- 12)  $-(C_0-C_4)$ -アルキレン- $C(O)-O-R^{11}$ 、
- 13)  $-(C_0-C_4)$ -アルキレン- $C(O)-N(R^{11})-R^{12}$ 、
- 14)  $-(C_0-C_4)$ -アルキレン- $N(R^{11})-R^{12}$ 、
- 15)  $-(C_0-C_2)$ アルキレン- $C(O)-O-(C_2-C_4)$ -アルキレン- $O-C(O)-(C_1-C_4)$ -アルキル、
- 16)  $-C(O)-O-C(R^{15}, R^{16})-O-C(O)-R^{17}$ 、
- 17)  $-(C_0-C_2)$ アルキレン- $C(O)-O-(C_2-C_4)$ -アルキレン- $O-C(O)-O-(C_1-C_6)$ -アルキル、
- 18)  $-C(O)-O-C(R^{15}, R^{16})-O-C(O)-O-R^{17}$ 、
- 19)  $-(C_0-C_4)$ -アルキレン- $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、ここでシクロアルキルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^{13}$ によりモノ -、ジ - またはトリ置換されている、
- 20)  $-(C_0-C_3)$ -アルキレン- $O-CH_2-CF_2-CH_2-O-(C_0-C_3)$ -アルキル、
- 21)  $-(C_0-C_3)$ -アルキレン- $O-CH_2-CF_2-CF_2-CH_2-O-(C_0-C_3)$ -アルキル、
- 22)  $-(C_0-C_3)$ -アルキレン- $O-CH_2-(C_1-C_3)$ -ペルフルオロアルキレン- $CH_2-OH$ 、または
- 23) 次のものから選択される残基

## 【化2】



(式中、Meはメチルである)

であり、

$R^{11}$ および $R^{12}$ は互いに独立して同じかまたは異なって、そして

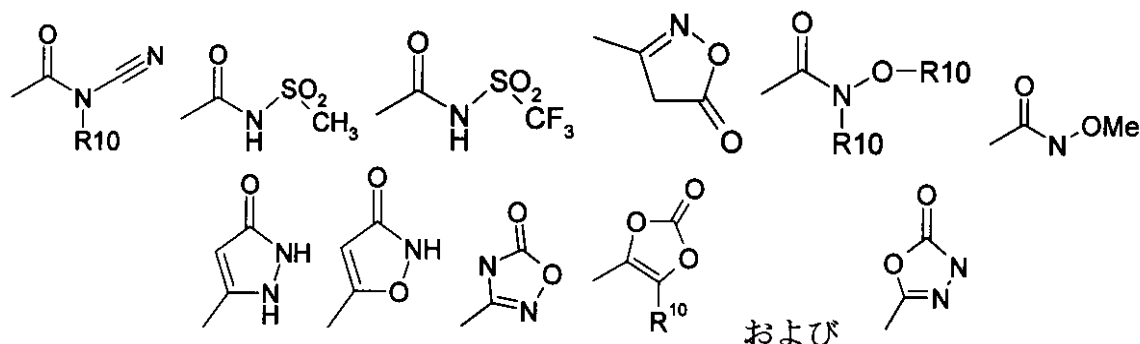
- 1) 水素原子、
- 2)  $-(C_1-C_4)$ -アルキル、ここでアルキルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^{13}$ によりモノ -、ジ - またはトリ置換されている、
- 3)  $-(C_0-C_6)$ -アルキル- $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、
- 4)  $-O-R^{17}$ 、または
- 5)  $-(C_0-C_6)$ -アルキル- $(C_4-C_{15})$ -ヘテロシクリル、ここでアルキルおよびヘテロシクリルは互いに独立して非置換であるかまたは $R^{13}$ によりモノ -、ジ - またはトリ置換されており、そしてここでヘテロシクリルはアゼチジン、シクロプロピル、シクロブチル、4,5-ジヒドロ-オキサゾール、イミダゾリジン、モルホリン、(1,4)-オキサゼパン、オキサゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、ピロリジン、テトラヒドロチオフェン、チアゾリジンまたはチオモルホリンからなる群より選択される、

であるか、または

$R^{11}$  および  $R^{12}$  はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、アゼチジン、シクロプロピル、シクロブチル、4,5-ジヒドロ-オキサゾール、イミダゾリジン、モルホリン、(1,4)-オキサゼパン、1,4-オキサゼピン、オキサゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、ピロリジン、テトラヒドロチオフェン、チアゾリジンまたはチオモルホリンからなる群より選択される複素環式環を形成し、

$R^{13}$  は、フッ素、 $-\text{CN}$ 、 $=\text{O}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{O}-R^{10}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(R^{10})-R^{20}$ 、 $-\text{N}(R^{10})-R^{20}$ 、 $-(\text{C}_3-\text{C}_6)$ -シクロアルキル、 $-(\text{C}_0-\text{C}_3)$ -アルキレン- $\text{O}-R^{10}$ 、 $-\text{Si}-(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{S}-R^{10}$ 、 $-\text{SO}_2-R^{10}$ 、 $-(\text{C}_1-\text{C}_3)$ -ペルフルオロアルキル、または次のものから選択される残基

【化3】



(式中、Meはメチルである)

であり、

$R^{10}$  および  $R^{20}$  は互いに独立して水素、 $-(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -アルキルまたは $-(\text{C}_1-\text{C}_3)$ -ペルフルオロアルキルであり、

$R^{15}$  および  $R^{16}$  は互いに独立して水素、 $-(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -アルキルであるか、または一緒にあってシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルからなる群より選択される環を形成し、ここで各環は非置換であるかまたは $R^{10}$  により1～3回置換されており、そして

$R^{17}$  は $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -アルキル、 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -アルキル- $\text{OH}$ 、 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -アルキル- $\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -アルキル、 $-(\text{C}_3-\text{C}_8)$ -シクロアルキル、 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -アルキル- $\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_8)$ -アルキル- $-(\text{C}_3-\text{C}_8)$ -シクロアルキル、 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -アルキル- $-(\text{C}_3-\text{C}_8)$ -シクロアルキルであり、ここで該シクロアルキル環は非置換であるかまたは $-\text{OH}$ 、 $-\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -アルキルまたは $R^{10}$  により1、2または3回置換されている。

【請求項2】

式Iにおいて、

$R^0$  はチエニル、チアジアゾリル、イソオキサゾリルおよびチアゾリルの群より選択されるヘテロシクリルであり、ここで該ヘテロシクリルはチエニル、2-チエニルおよび3-チエニルの群より選択される残基により置換されており、ここで該残基は非置換であるかまたは互いに独立して $R^8$  によりモノ-またはジ置換されており、

$R^8$  はF、Cl、Br、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}_2$ または $-\text{O}-\text{CF}_3$ であり、

Qはメチレンまたはエチレンであり、

$R^1$  は水素原子であり、

$R^2$  は直接結合またはメチレンであり、

$R^1-\text{N}-R^2-\text{V}$  はピペラジン、ピペリジンおよびピロリジンの群より選択される4～8員の環式基を形成することができ、

$R^{14}$  はフッ素、塩素、メチル、エチルまたは $-\text{NH}_2$ であり、

Vは、

1. アザインドリル(1H-ピロロピリジル)、アゼチジン、1,4-ジアゼパン、イソオキサゾール、イソキノリン、ピペラジン、ピペリジン、ピラジン、ピリダジン、ピリミジン、ピロリジン、キナゾリンまたはキノリンから誘導される化合物を含む群より選択される残

基、

ここで該環式残基は非置換であるかまたは互いに独立して $R^{14}$ によりモノ - またはジ置換されている、または

2. フェニル、ここでフェニルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^{14}$ によりモノ - またはジ置換されている、  
であり、

Gは直接結合、 $-(CH_2)_m$ -または $-(CH_2)_m-NR^{10}$ -であり、

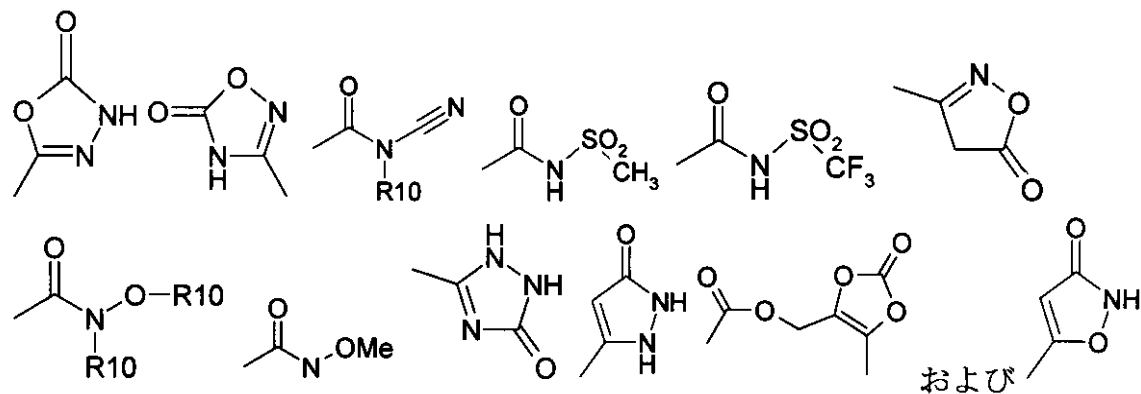
mは0、1または2の整数であり、

Mは水素原子、 $(C_2-C_4)$ -アルキル、アゼピニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、イミダゾリル、ケトモルホリニル、モルホリニル、ピペリジニル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピロリジニル、1,4,5,6-テトラヒドロ-ピリダジニル、またはテトラヒドロピラニルであり、ここでこれらの残基は非置換であるかまたは互いに独立して $R^{14}$ によりモノ - またはジ置換されており、

$R^3$ および $R^4$ は互いに独立して同じかまたは異なって、そして

- 1) 水素原子、
- 2) フッ素、塩素、
- 3)  $-(C_1-C_4)$ -アルキル、ここでアルキルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^{13}$ によりモノ - 、ジ - またはトリ置換されている、
- 4)  $-(C_1-C_3)$ -ペルフルオロアルキル、
- 5) フェニル、ここでフェニルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^{13}$ によりモノ - 、ジ - またはトリ置換されている、
- 6)  $-(C_0-C_2)$ -アルキレン-O- $R^{19}$ 、ここで $R^{19}$ は
  - a) 水素原子、
  - b)  $-(C_1-C_4)$ -アルキル、ここでアルキルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^{13}$ によりモノ - 、ジ - またはトリ置換されている、
  - c) フェニル、ここでフェニルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^{13}$ によりモノ - 、ジ - またはトリ置換されている、
  - d)  $-CF_3$ 、または
  - e)  $-CHF_2$ 、である、
- 7)  $-CN$ 、
- 8)  $-NR^{10}-SO_2-R^{10}$ 、
- 9)  $-SO_s-R^{11}$ 、ここでsは1または2である、
- 10)  $-SO_t-N(R^{11})-R^{12}$ 、ここでtは1または2である、
- 11)  $-(C_0-C_4)$ -アルキレン-C(O)- $R^{11}$ 、
- 12)  $-(C_0-C_4)$ -アルキレン-C(O)-O- $R^{11}$ 、
- 13)  $-(C_0-C_4)$ -アルキレン-C(O)-N( $R^{11}$ )- $R^{12}$ 、
- 14)  $-(C_0-C_4)$ -アルキレン-N( $R^{11}$ )- $R^{12}$ 、
- 15)  $-(C_0-C_2)$ アルキレン-C(O)-O- $(C_2-C_4)$ -アルキレン-O-C(O)- $(C_1-C_4)$ -アルキル、
- 16)  $-C(O)-O-C(R^{15}, R^{16})-O-C(O)-R^{17}$ 、
- 17)  $-(C_0-C_2)$ アルキレン-C(O)-O- $(C_2-C_4)$ -アルキレン-O-C(O)-O- $(C_1-C_6)$ -アルキル、
- 18)  $-C(O)-O-C(R^{15}, R^{16})-O-C(O)-O-R^{17}$ 、
- 19)  $-(C_0-C_3)$ -アルキレン- $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、ここでシクロアルキルは非置換であるかまたは互いに独立して $R^{13}$ によりモノ - 、ジ - またはトリ置換されている、
- 20)  $-(C_0-C_3)$ -アルキレン-O- $CH_2-CF_2-CH_2-O-(C_0-C_3)$ -アルキル、
- 21)  $-(C_0-C_3)$ -アルキレン-O- $CH_2-CF_2-CF_2-CH_2-O-(C_0-C_3)$ -アルキル、
- 22)  $-(C_0-C_3)$ -アルキレン-O- $CH_2-(C_1-C_3)$ -ペルフルオロアルキレン- $CH_2-OH$ 、または
- 23) 次のものから選択される残基

## 【化4】



(式中、Meはメチルである)

であり、

$R^{11}$  および  $R^{12}$  は互いに独立して同じかまたは異なって、そして

- 1) 水素原子、
- 2)  $-(C_1-C_4)$ -アルキル、ここでアルキルは非置換であるかまたは互いに独立して  $R^{13}$  によりモノ -、ジ - またはトリ置換されている、
- 3)  $-(C_0-C_6)$ -アルキル- $(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、
- 4)  $-O-R^{17}$ 、または
- 5)  $-(C_0-C_6)$ -アルキル-ヘテロシクリル、ここでアルキルおよびヘテロシクリルは互いに独立して非置換であるかまたは  $R^{13}$  によりモノ -、ジ - またはトリ置換されており、そしてここでヘテロシクリルはアゼチジン、イミダゾリジン、モルホリン、(1,4)-オキサゼパンまたはピロリジンの群より選択される、

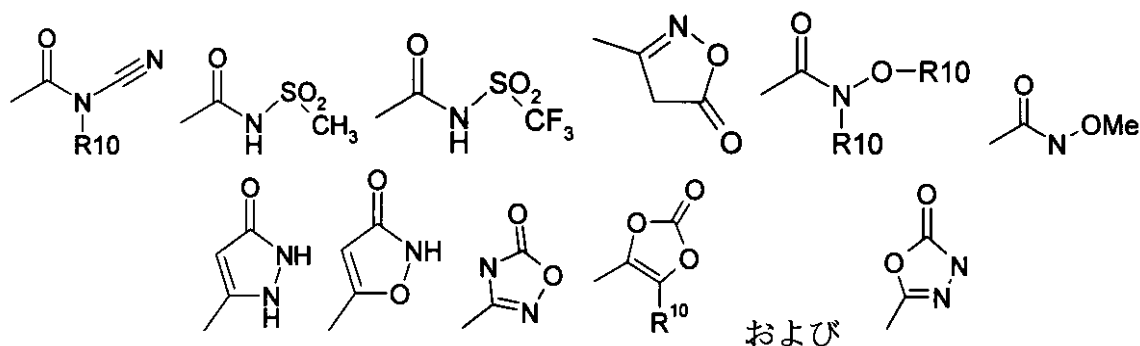
であるか、または

$R^{11}$  および  $R^{12}$  は、それらが結合している窒素原子と一緒に、アゼチジン、イミダゾリジン、モルホリン、(1,4)-オキサゼパン、1,4-オキサゼピン、ピペラジン、ピペリジン、ピロリジンまたはチオモルホリンの群より選択される環を形成することができ、

$R^{13}$  はフッ素、 $-CN$ 、 $=O$ 、 $-OH$ 、 $-CF_3$ 、 $-C(O)-O-R^{10}$ 、 $-C(O)-N(R^{10})-R^{20}$ 、 $-N(R^{10})-R^{20}$ 、 $-(C_3-C_6)$ -シクロアルキル、 $-(C_0-C_3)$ -アルキレン- $O-R^{10}$ 、 $-Si-(CH_3)_3$ 、 $-S-R^{10}$ 、 $-SO_2-R^{10}$ 、 $-(C_1-C_3)$ -ペルフルオロアルキルであるか、または次のもの

から選択される残基

## 【化5】



(式中、Meはメチルである)

であり、

$R^{10}$  および  $R^{20}$  は互いに独立して水素、 $-(C_1-C_4)$ -アルキルまたは $-(C_1-C_3)$ -ペルフルオロアルキルであり、

$R^{15}$  および  $R^{16}$  は互いに独立して水素、 $-(C_1-C_4)$ -アルキルであるか、または一緒になってシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルの群より選択される環を形成し、ここで各環は非置換であるかまたは  $R^{10}$  により1~3回置換されており、

そして

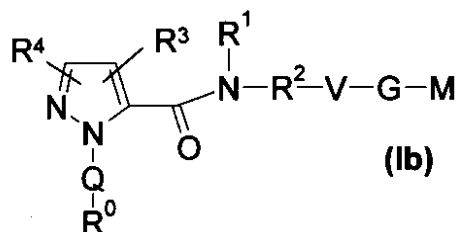
$R^{17}$  は  $-(C_1-C_6)$ -アルキル、 $-(C_1-C_6)$ -アルキル-OH、 $-(C_1-C_6)$ -アルキル-O- $-(C_1-C_6)$ -アルキル、 $-(C_3-C_8)$ -シクロアルキル、 $-(C_1-C_6)$ -アルキル-O- $-(C_1-C_8)$ -アルキル- $-(C_3-C_8)$ -シクロアルキル、 $-(C_1-C_6)$ -アルキル- $-(C_3-C_8)$ -シクロアルキルであり、ここで該シクロアルキル環は非置換であるか、または-OH、-O- $-(C_1-C_4)$ -アルキルまたは $R^{10}$ により1、2または3回置換されている、

請求項1に記載の化合物、その全ての立体異性体および該立体異性体のいかなる配合比の混合物、およびその生理学的に忍容性のある塩。

【請求項3】

式Iの化合物が、式Ib

【化6】

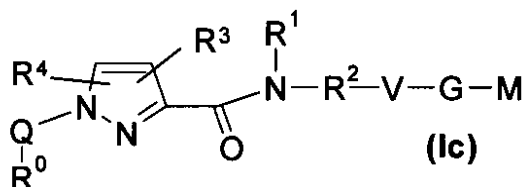


(式中、 $R^0$  ;  $R^1$  ;  $R^2$  ;  $R^3$  ;  $R^4$  ; Q ; V、GおよびMは請求項1に記載の式Iにおいて示した意味を有する)の化合物である、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

式Iの化合物が、式Ic

【化7】



(式中、 $R^0$  ;  $R^1$  ;  $R^2$  ;  $R^3$  ;  $R^4$  ; Q ; V、GおよびMは請求項1に記載の式Iにおいて示した意味を有する)の化合物である、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

式Iの化合物が次のものである請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物：

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-チオフェン-2-イル-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-チオフェン-2-イル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-メチル-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-メチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-4-(2,4-ジクロロ-フェニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、



2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロ

ピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 エチルエステル、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 エチルエステル、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(モルホリン-4-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(モルホリン-4-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-ジメチルアミド 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]

、  
1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-ジメチルアミド 3-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]

、  
1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-[(2-ヒドロキシ-エチル)-アミド] 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-[(2-ヒドロキシ-エチル)-アミド] 3-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

{ [1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ } -酢酸、

{ [2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ } -酢酸、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(5-オキソ-4,5-ジヒドロ-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(5-オキソ-4,5-ジヒドロ-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

硫酸 モノ-(2-{ [1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ } -エチル) エステル、

硫酸 モノ-(2-{ [2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ } -エチル) エステル、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-カルボニル]-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-カルボニル]-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド] 3-[(2-モルホリン-4-イル-エチル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド] 5-[(2-モルホリン-4-イル-エチル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-[ビス-(2-メトキシ-エチル)-アミド] 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-[ビス-(2-メトキシ-エチル)-アミド] 3-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-[(4,5-ジヒドロ-オキサゾール-2-イル)-アミド] 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-[(4,5-ジヒドロ-オキサゾール-2-イル)-アミド] 3-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

2-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-[3-(2-ヒドロキシ-エチル)-2-オキソ-イミダゾリジン-1-カルボニル]-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-[3-(2-ヒドロキシ-エチル)-2-オキソ-イミダゾリジン-1-カルボニル]-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(2-メトキシメチル-ピロリジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(2-メトキシメチル-ピロリジン-1-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

{ [1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-メチル-アミノ } -酢酸、

{ [2-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-メチル-アミノ } -酢酸、

1-[1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-ピペリジン-4-カルボン酸 エチルエステル、

1-[2-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-ピペリジン-4-カルボン酸 エチルエステル、

1-[1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-アゼチジン-2-カルボン酸、

1-[2-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アゼチジン-2

-カルボン酸、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(チオモルホリン-4-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(チオモルホリン-4-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-ピロリジン-2-カルボン酸、

1-[2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-ピロリジン-2-カルボン酸、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(2-ヒドロキシメチル-ピロリジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(2-ヒドロキシメチル-ピロリジン-1-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(3-ヒドロキシ-ピロリジン-1-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

5-(2,5-ビス-メトキシメチル-ピロリジン-1-カルボニル)-2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

5-(2,5-ビス-メトキシメチル-ピロリジン-1-カルボニル)-1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

5-(8-アザ-スピロ[4.5]デカン-8-カルボニル)-2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

5-(8-アザ-スピロ[4.5]デカン-8-カルボニル)-1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(3-メタンス

ルホニル-ピロリジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(3-メタンシルホニル-ピロリジン-1-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-[(1,1-ジオキソ-テトラヒドロ-1-チオフェン-3-イル)-メチル-アミド] 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-[(1,1-ジオキソ-テトラヒドロ-1-チオフェン-3-イル)-メチル-アミド] 3-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

1-[1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-アゼチジン-3-カルボン酸、

1-[2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アゼチジン-3-カルボン酸、

5-(アゼチジン-1-カルボニル)-2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

5-(アゼチジン-1-カルボニル)-1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(3-オキソ-ピペラジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(3-オキソ-ピペラジン-1-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(4,4-ジフルオロ-ピペリジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(4,4-ジフルオロ-ピペリジン-1-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-([1,4]オキサゼパン-4-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-([1,4]オキサゼパン-4-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(3-ヒドロキシ-アゼチジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(3-ヒドロキシ-アゼチジン-1-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(2-トリフルオロメチル-ピロリジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(2-トリフルオロメチル-ピロリジン-1-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(2,2-ジメチル-ピロリジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(2,2-ジメチル-ピロリジン-1-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド] 3-[(2-スルファモイル-エチル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド] 5-[(2-スルファモイル-エチル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-シクロプロピルアミド 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-シクロプロピルアミド 3-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

{ [1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ } -メタンスルホン酸、

{ [2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ } -メタンスルホン酸、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-シクロブチルアミド 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-シクロブチルアミド 3-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド] 3-[(2-メトキシ-エチル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド] 5-[(2-メトキシ-エチル)-アミド]、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(ピロリジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(ピロリジン-1-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(シアナミド-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(シアナミド-1-カルボニル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-ア

ミド、

リン酸 モノ-(2-{[1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-エチル) エステル、

リン酸 モノ-(2-{[2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-エチル) エステル、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 ビス-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-4-シアノ-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-4-シアノ-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

3-{[1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-プロピオン酸、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド] 3-(メトキシ-アミド)、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-カルバモイルメチル-アミド 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

{[1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-酢酸 エチルエステル、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-[(3-ヒドロキシ-プロピル)-アミド] 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

1-[1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-(2S)-アゼチジン-2-カルボン酸、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(2S,2-ヒドロキシメチル-ピロリジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-2S-ピロリジン-2-カルボン酸、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(2S,2-メトキシメチル-ピロリジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

5-(2R,5R,2,5-ビス-メトキシメチル-ピロリジン-1-カルボニル)-2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-[(4,5-ジヒドロ-オキサゾール-2-イル)-アミド] 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

1-[1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-ピペリジン-4-

-カルボン酸 エチルエステル、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド] 3-[(2-モルホリン-4-イル-エチル)-アミド]、

2-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(4,4-ジフルオロ-ピペリジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(2-オキソ-オキサゾリジン-3-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド] 3-{[2-(2-オキソ-イミダゾリジン-1-イル)-エチル]-アミド}、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド] 3-[(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-[(1,1-ジオキソ-テトラヒドロ-1-チオフエン-3-イル)-アミド] 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド] 3-{[3-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-プロピル]-アミド}、

5-(アゼチジン-1-カルボニル)-2-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(チアゾリジン-3-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-{[1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-3,3-トリフルオロ-プロピオン酸、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド] 3-トリメチルシランメチル-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-[4-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-ピペリジン-1-カルボニル]-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-メタンスルホニルアミノカルボニル-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(3-ヒドロキシ-アゼチジン-1-カルボニル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-フラン-2-イル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸、

5-(アゼチジン-1-カルボニル)-1-[5-(5-クロロ-チオフエン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、



1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド] 5-[(2-スルファモイル-エチル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-[ビス-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミド] 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-1H-ピラゾール-3,5-ジカルボン酸 3-[(2-ヒドロキシ-1,1-ビス-ヒドロキシメチル-エチル)-アミド] 5-[(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド]、

{ [1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ } -酢酸 イソプロピルエステル、

2- { [1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ } -3-メチル-酪酸 エチルエステル、

2- { [1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ } -3-メチル-酪酸、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-フラン-2-イル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 [4-(3-オキソ-モルホリン-4-イル)-フェニル]-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-ヒドロキシメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 [4-(3-オキソ-モルホリン-4-イル)-フェニル]-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-[2-(2-メトキシ-エトキシ)-エトキシメチル]-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

2-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(2-メトキシ-エトキシメチル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 (1-イソプロピル-ピペリジン-4-イル)-アミド、

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 2-ヒドロキシ-エチルエステル、または

1-[5-(5-クロロ-チオフェン-2-イル)-イソオキサゾール-3-イルメチル]-5-(1-イソプロピル-ピペリジン-4-イルカルバモイル)-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 カルボキシメチルエステル。