

【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】令和1年11月14日(2019.11.14)

【公表番号】特表2018-529744(P2018-529744A)

【公表日】平成30年10月11日(2018.10.11)

【年通号数】公開・登録公報2018-039

【出願番号】特願2018-517526(P2018-517526)

【国際特許分類】

C 07 D 231/14 (2006.01)
A 61 P 11/00 (2006.01)
A 61 P 11/06 (2006.01)
A 61 P 43/00 (2006.01)
A 61 P 31/00 (2006.01)
A 61 P 37/06 (2006.01)
A 61 P 13/12 (2006.01)
A 61 P 9/12 (2006.01)
A 61 P 9/10 (2006.01)
A 61 P 9/04 (2006.01)
A 61 P 25/16 (2006.01)
A 61 P 25/28 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 21/00 (2006.01)
A 61 P 25/02 (2006.01)
A 61 P 1/04 (2006.01)
A 61 P 35/00 (2006.01)
A 61 P 27/02 (2006.01)
A 61 P 27/14 (2006.01)
A 61 P 1/16 (2006.01)
A 61 P 3/06 (2006.01)
A 61 P 39/02 (2006.01)
A 61 P 17/06 (2006.01)
A 61 P 37/02 (2006.01)
A 61 P 13/02 (2006.01)
A 61 P 9/00 (2006.01)
A 61 P 17/16 (2006.01)
A 61 K 31/415 (2006.01)
C 07 D 231/56 (2006.01)
A 61 K 31/416 (2006.01)
A 61 K 31/454 (2006.01)
A 61 K 31/438 (2006.01)
C 07 D 401/10 (2006.01)
C 07 D 403/10 (2006.01)
A 61 K 31/55 (2006.01)
C 07 D 401/14 (2006.01)
A 61 K 31/4545 (2006.01)
A 61 K 31/4192 (2006.01)
C 07 D 403/14 (2006.01)

【F I】

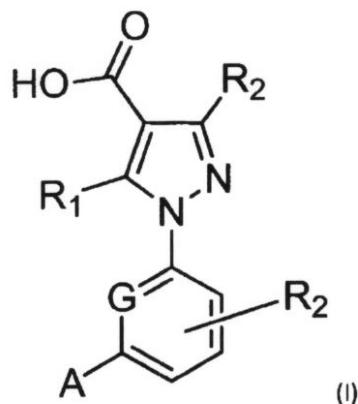
C 07 D 231/14 C S P

A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 P	31/00	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	25/02	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	27/14	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 P	39/02	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	13/02	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	17/16	
A 6 1 K	31/415	
C 0 7 D	231/56	Z
A 6 1 K	31/416	
A 6 1 K	31/454	
A 6 1 K	31/438	
C 0 7 D	401/10	
C 0 7 D	403/10	
A 6 1 K	31/55	
C 0 7 D	401/14	
A 6 1 K	31/4545	
A 6 1 K	31/4192	
C 0 7 D	403/14	

【手続補正書】**【提出日】**令和1年10月2日(2019.10.2)**【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)の化合物またはその薬学上許容可能な塩：

【化1】



[式中、

R_1 は、 $-CF_3$ 、 $-C_3-7$ シクロアルキル、または $-C_4-7$ ヘテロシクロアルキルであり、ここで、前記 $-C_3-7$ シクロアルキルおよび $-C_4-7$ ヘテロシクロアルキルは、非置換であるか、または $-C_{1-3}$ アルキル、フェニル、トリアゾリル、ピリジル、ピリダジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、イソキサゾリル、ハロ、 $-NR_9-C(O)-R_{10}$ および $-C(O)R_{10}$ から独立に選択される1もしくは2個の置換基で置換され、ここで、前記フェニル、トリアゾリル、ピリジル、ピリダジニル、イミダゾリル、ピラゾリルおよびイソキサゾリルは、 $-C_{1-3}$ アルキルおよびハロから独立に選択される1または2個の置換基で置換され；あるいは

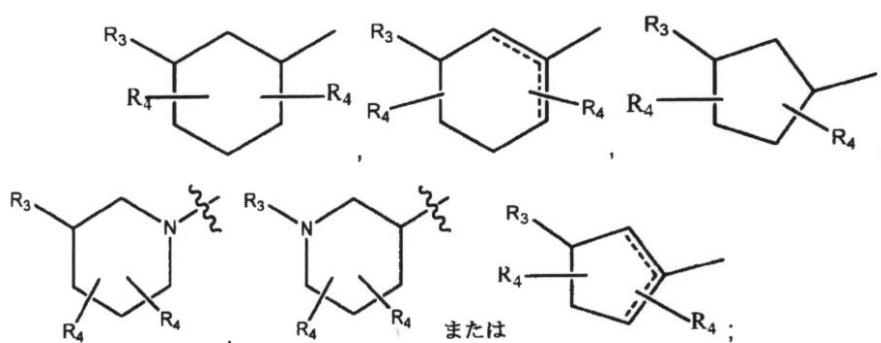
R_1 は、 $-C_{2-3}$ アルキル $-R_{11}$ であり；

各 R_2 は独立に、水素、ハロ、または $-C_{1-3}$ アルキルであり；

G は、 C H または N であり；

A は、

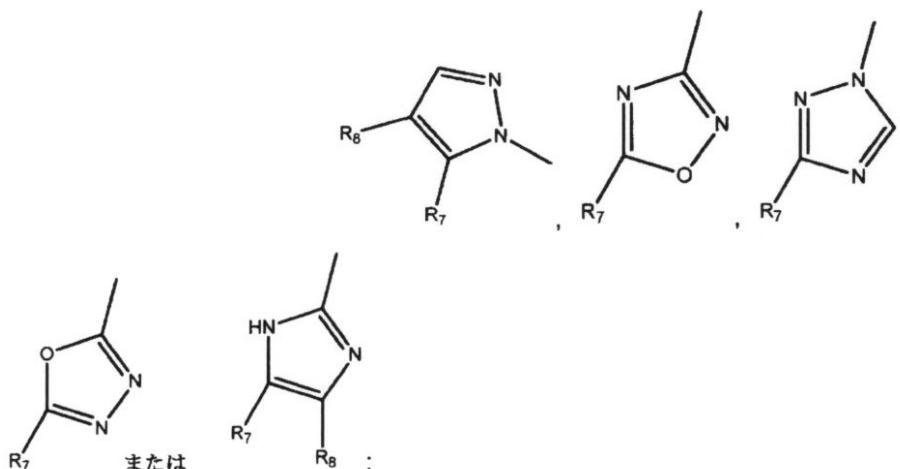
【化2】



であり；

R_3 は、 $- (CH_2)_n - C(O)N(R_5)(R_6)$ 、

【化3】



であるか；

あるいは、R₃は、-O-C₁-₃アルキル、-C₁-₆アルキル、-C₄-₇ヘテロシクロアルキル、-O-C₄-₇ヘテロシクロアルキル、-C₃-₇シクロアルキル、-O-C₃-₇シクロアルキル、-C(O)-O-C₁-₅アルキル、-C(O)-C₁-₅アルキル、-C(O)-アリール、-S-C₁-₃アルキル、-S-C₄-₇ヘテロシクロアルキル、-S-C₃-₇シクロアルキル、-S(O)-C₁-₃アルキル、-S(O)-C₄-₇ヘテロシクロアルキル、-S(O)-C₃-₇シクロアルキル、-S(O)₂-C₁-₃アルキル、-S(O)₂-C₄-₇ヘテロシクロアルキル、-S(O)₂-C₃-₇シクロアルキル、-S(O)₂-アリールであり、ここで、-O-C₁-₃アルキル、-C₁-₆アルキル、-C₄-₇ヘテロシクロアルキル、-O-C₃-₇シクロアルキル、-C(O)-C₁-₅アルキル、-C(O)-アリール、-S-C₁-₃アルキル、-S-C₄-₇ヘテロシクロアルキル、-S-C₃-₇シクロアルキル、-S(O)-C₁-₃アルキル、-S(O)-C₄-₇ヘテロシクロアルキル、-S(O)-C₃-₇シクロアルキル、-S(O)₂-C₁-₃アルキル、-S(O)₂-C₄-₇ヘテロシクロアルキル、-S(O)₂-C₃-₇シクロアルキル、-S(O)₂-アリールのそれぞれは、非置換であるか、または-C₁-₇アルキル、-C₃-₇シクロアルキル、-OH、=O、-O-C₁-₅アルキル、-C₄-₇ヘテロシクロアルキル、フェニル、ピリジル、ピラゾリル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、もしくはトリアゾリルから独立に選択される1もしくは2個の置換基で置換され、ここで、前記-C₁-₇アルキル、-C₃-₇シクロアルキル、-O-C₁-₃アルキル、-C₄-₇ヘテロシクロアルキル、フェニル、ピリジル、ピラゾリル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、またはトリアゾリルは、非置換であるか、またはC₁-₅アルキルおよびハロから独立に選択される1もしくは2個の置換基で置換され；

各R₄は独立に、水素、ハロまたは-C₁-₃アルキルであり；

R₅およびR₆は独立に、H、-C₁-₆アルキル、-C₃-₇シクロアルキルまたは-C₄-₇ヘテロシクロアルキルであり、ここで、-C₁-₆アルキル、-C₃-₇シクロアルキルまたは-C₄-₇ヘテロシクロアルキルのそれぞれは、非置換であるか、またはF、-CH₂F₂、-CF₃、-(CH₂)_n-O-(CH₂)_m-CH₃、および-C₃-₇シクロアルキルから独立に選択される1もしくは2個の置換基で置換され；

あるいは、R₅およびR₆は、それらが結合している窒素原子と一緒に5～8員環または8～10員二環式環または9～10員架橋二環式環を形成し、ここで、各5～8員環、8～11員二環式環、または9～10員架橋二環式環は、1個以上の酸素環原子または別の窒素環原子を含んでもよく、かつ、各5～8員環、8～11員二環式環、または9～10員架橋二環式環は、非置換であるか、または-C₁-₅アルキル、-C₃-₇シクロア

ルキル、 $-C_{4\sim7}$ ヘテロシクロアルキル、F、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、および $-(CH_2)_n-O-(CH_2)_m-CH_3$ から独立に選択される1もしくは2個の置換基で置換され；

あるいは、R₅およびR₆は、それらが結合している窒素原子と一緒に、4-アザスピロ[2.5]オクタン、7-アザスピロ[4.5]デカン、2-オキサ-8-アザスピロ[5.5]ウンデカン、6-オキサ-9-アザスピロ[4.5]デカン、2-オキサ-8-アザスピロ[5.5]ウンデカン、または1-アザスピロ[4.5]デカンを形成し；

R₇およびR₈は独立に、H、 $-C_{1\sim6}$ アルキル、 $-C_{3\sim7}$ シクロアルキルまたは $-C_{4\sim7}$ ヘテロシクロアルキルであり、ここで、 $-C_{1\sim6}$ アルキル、 $-C_{3\sim7}$ シクロアルキルまたは $-C_{4\sim7}$ ヘテロシクロアルキルのそれぞれは、非置換であるか、またはF、 CHF_2 、 CF_3 、および $(CH_2)_n-O-(CH_2)_m-CH_3$ から独立に選択される1もしくは2個の置換基で置換され；

あるいは、R₇およびR₈は、それらが結合している炭素原子と一緒に5~8員環を形成し、これは1個以上の酸素または窒素原子を環原子として含んでもよく、かつ、前記5~8員環は、非置換であるか、または $-C_{1\sim5}$ アルキル、 $-C_{3\sim7}$ シクロアルキル、 $-C_{4\sim7}$ ヘテロシクロアルキル、F、 CHF_2 、 CF_3 、=O、および $-(CH_2)_n-O-(CH_2)_m-CH_3$ から独立に選択される1もしくは2個の置換基で置換され；

R₉は、Hまたは $-C_{1\sim3}$ アルキルであり；

R₁₀は、 $-C_{1\sim3}$ アルキルであり；

R₁₁は、フェニル、トリアゾリル、ピリジル、ピリダジニル、イミダゾリル、またはピラゾリルであり、ここで、フェニル、トリアゾリル、ピリジル、ピリダジニル、イミダゾリル、またはピラゾリルのそれぞれは、非置換であるか、または $C_{1\sim3}$ アルキルおよびハロから独立に選択される1もしくは2個の置換基で置換され；

各nは独立に、0または1であり；

各mは独立に、0または1である】。

【請求項2】

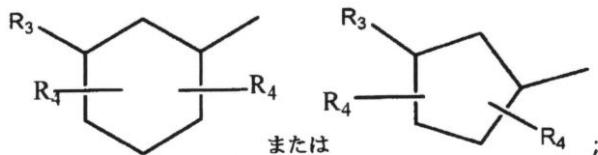
R₁が $-CF_3$ 、 $-C_{3\sim7}$ シクロアルキルであり、ここで、前記 $-C_{3\sim7}$ シクロアルキルは、非置換であるか、または $-C_{1\sim3}$ アルキルおよびハロから選択される1もしくは2個の置換基で置換され、あるいは前記 $-C_{3\sim7}$ シクロアルキルは、トリアゾリル、ピリジル、ピリダジニル、イミダゾリル、ピラゾリルおよびイソキサゾリルから選択される1個の置換基で置換され、ここで、前記トリアゾリル、ピリジル、ピリダジニル、イミダゾリル、ピラゾリルおよびイソキサゾリルは、非置換であるか、または $-C_{1\sim3}$ アルキルおよびハロから選択される1もしくは2個の置換基で置換され；

R₂が水素であり；

GがCHであり；

Aが

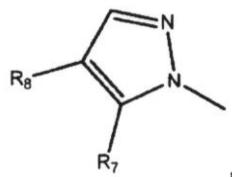
【化4】



であり；

R₃が $-(CH_2)_n-C(O)N(R_5)(R_6)$ 、

【化5】



であり、あるいは、

R_3 は、 $-O-C_{1\sim 3}$ アルキル、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-C_{4\sim 7}$ ヘテロシクロアルキル、 $-O-C_{4\sim 7}$ ヘテロシクロアルキル、 $-C_{3\sim 7}$ シクロアルキル、または $-O-C_{3\sim 7}$ シクロアルキルであり、ここで、 $-O-C_{1\sim 3}$ アルキル、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-C_{4\sim 7}$ ヘテロシクロアルキル、 $-O-C_{4\sim 7}$ ヘテロシクロアルキル、 $-C_{3\sim 7}$ シクロアルキル、 $-O-C_{3\sim 7}$ シクロアルキルのそれぞれは、非置換であるか、または $-C_{1\sim 7}$ アルキル、 $-C_{3\sim 7}$ シクロアルキル、 $-OH$ 、 $=O$ 、 $-O-C_{1\sim 5}$ アルキル、 $-C_{4\sim 7}$ ヘテロシクロアルキル、フェニル、ピリジル、ピラゾリル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、およびトリアゾリルから選択される1もしくは2個の置換基で置換され、ここで、前記 $-C_{1\sim 7}$ アルキル、 $-C_{3\sim 7}$ シクロアルキル、 $-O-C_{1\sim 3}$ アルキル、 $-C_{4\sim 7}$ ヘテロシクロアルキル、フェニル、ピリジル、ピラゾリル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、またはトリアゾリルは、非置換であるか、または $-C_{1\sim 5}$ アルキルおよびハロから独立に選択される1もしくは2個の置換基でさらに置換され；

各 R_4 が独立に水素、ハロ、または $-C_{1\sim 3}$ アルキルであり；

R_5 および R_6 が独立に H 、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-C_{3\sim 7}$ シクロアルキルまたは $-C_{4\sim 7}$ ヘテロシクロアルキルであり、ここで、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-C_{3\sim 7}$ シクロアルキルまたは $-C_{4\sim 7}$ ヘテロシクロアルキルのそれぞれは、非置換であるか、または F 、 $-CH-F_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-(CH_2)_n-O-(CH_2)_m-CH_3$ 、もしくは $-C_{3\sim 7}$ シクロアルキルから独立に選択される1もしくは2個の置換基で置換され；

あるいは、 R_5 および R_6 は、それらが結合している窒素原子と一緒に5~8員環または8~10員二環式環または9~10員架橋二環式環を形成し、ここで、各5~8員環、8~11員二環式環、または9~10員架橋二環式環は、1個以上の酸素環原子または別の窒素環原子を含んでもよく、かつ、各5~8員環、8~11員二環式環、または9~10員架橋二環式環は、非置換であるか、または $-C_{1\sim 5}$ アルキル、 $-C_{3\sim 7}$ シクロアルキル、 $-C_{4\sim 7}$ ヘテロシクロアルキル、 F 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、および $-(CH_2)_n-O-(CH_2)_m-CH_3$ から独立に選択される1もしくは2個の置換基で置換され；

あるいは、 R_5 および R_6 が、それらが結合している窒素原子と一緒に、4-アザスピロ[2.5]オクタン、7-アザスピロ[4.5]デカン、2-オキサ-8-アザスピロ[5.5]ウンデカン、6-オキサ-9-アザスピロ[4.5]デカン、2-オキサ-8-アザスピロ[5.5]ウンデカン、または1-アザスピロ[4.5]デカンを形成；

R_7 および R_8 が独立に、 H 、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-C_{3\sim 7}$ シクロアルキルまたは $-C_{4\sim 7}$ ヘテロシクロアルキルであり、ここで、 $-C_{1\sim 6}$ アルキル、 $-C_{3\sim 7}$ シクロアルキルまたは $-C_{4\sim 7}$ ヘテロシクロアルキルのそれぞれは、非置換であるか、または F 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、および $-(CH_2)_n-O-(CH_2)_m-CH_3$ から独立に選択される1もしくは2個の置換基で置換され；

あるいは、 R_7 および R_8 は、それらが結合している炭素原子と一緒に5~8員環を形成し、これは1個以上の酸素または窒素原子を環原子として含んでもよく、かつ、前記5~8員環は、非置換であるか、または $-C_{1\sim 5}$ アルキル、 $-C_{3\sim 7}$ シクロアルキル、 $-C_{4\sim 7}$ ヘテロシクロアルキル、 F 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $=O$ 、および $-(CH_2)_n-O-(CH_2)_m-CH_3$ から独立に選択される1もしくは2個の置換基で置換さ

れ；

各nが独立に0または1であり；

各mが独立に0または1である、

請求項1に記載の化合物またはその薬学上許容可能な塩。

【請求項3】

5 - シクロプロピル - 1 - { 3 - [3 - (ジメチルカルバモイル)シクロヘキシリ]フェニル } - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸(シス・ラセミ化合物)；

5 - シクロプロピル - 1 - { 3 - [3 - (4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 H - インダゾール - 1 - イル)シクロヘキシリ]フェニル } - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸；

5 - シクロプロピル - 1 - { 3 - [3 - (ピペリジン - 1 - カルボニル)シクロヘキシリ]フェニル } - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸(シス・ラセミ化合物)；

1 - [3 - (3 - { 7 - アザスピロ [4 . 5] デカン - 7 - カルボニル}シクロヘキシリ]フェニル] - 5 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸(シス・ラセミ化合物)；

5 - シクロプロピル - 1 - { 3 - [3 - (2 - プロピルペリジン - 1 - カルボニル)シクロヘキシリ]フェニル } - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸；

5 - シクロプロピル - 1 - { 3 - [3 - (2 , 2 - ジメチルピロリジン - 1 - カルボニル)シクロヘキシリ]フェニル } - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸；

1 - [3 - (3 - { 1 - アザスピロ [4 . 5] デカン - 1 - カルボニル}シクロヘキシリ]フェニル] - 5 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸；

1 - { 3 - [3 - (2 - ブチルピロリジン - 1 - カルボニル)シクロヘキシリ]フェニル } - 5 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸；

1 - [3 - (3 - { 1 H , 4 H , 5 H , 6 H , 7 H , 8 H - シクロヘプタ [c] ピラゾール - 1 - イル}シクロヘキシリ]フェニル] - 5 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸；

1 - [3 - (3 - { 1 H , 4 H , 5 H , 6 H - シクロペンタ [c] ピラゾール - 1 - イル}シクロペンチル)フェニル] - 5 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸；

5 - シクロプロピル - 1 - (3 - { 3 - [2 - (3 - メチルブチル)ピロリジン - 1 - カルボニル)シクロヘキシリ]フェニル } - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸；

5 - シクロプロピル - 1 - { 3 - [3 - (2 - シクロプロピルピロリジン - 1 - カルボニル)シクロヘキシリ]フェニル } - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸；

1 - { 3 - [3 - (2 - シクロブチルピロリジン - 1 - カルボニル)シクロヘキシリ]フェニル } - 5 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸；

5 - シクロプロピル - 1 - { 3 - [(シス) - 3 - (6 - メチル - 5 , 6 - ジヒドロ - 4 H - シクロペンタピラゾール - 1 - イル) - シクロヘキシリ]フェニル } - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸(シスラセミ)；

5 - シクロプロピル - 1 - { 3 - [3 - (4 - オキソ - 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - インダゾール - 1 - イル) - シクロペンチル]フェニル } - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸；

5 - シクロプロピル - 1 - [3 - (3 - { 6 - プロピル - 1 H , 4 H , 5 H , 6 H - シクロペンタ [c] ピラゾール - 1 - イル}シクロヘキシリ)フェニル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸(シスラセミ)；

1 - { 3 - 3 - [2 - ブチルピロリジン - 1 - カルボニル]シクロヘキシリ]フェニル } - 5 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸；

5 - シクロプロピル - 1 - (3 - { 3 - [(2 S) - 2 - (エトキシメチル)ピロリジン - 1 - カルボニル]シクロヘキシリ]フェニル } - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸(分割されたシスジアステレオ異性体)；

5 - シクロプロピル - 1 - (3 - { 3 - [(2 S) - 2 - (エトキシメチル)ピロリジ

ン - 1 - カルボニル] シクロヘキシル } フェニル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸
(分割されたシスジアステレオ異性体) ;

1 - (5 ' - (アゼパン - 1 - カルボニル) - 2 ' , 3 ' , 4 ' , 5 ' - テトラヒドロ
- [1 , 1 ' - ビフェニル] - 3 - イル) - 5 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4
- カルボン酸 ;

1 - (3 - (3 - (アゼパン - 1 - カルボニル) シクロヘキシル) フェニル) - 5 - シ
クロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

1 - (3 - (3 - (シクロヘキシル (メチル) カルバモイル) シクロヘキシル) フェニ
ル) - 5 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

5 - シクロプロピル - 1 - (3 - (3 - (メチル (2 - プロピルシクロヘキシル) カル
バモイル) シクロヘキシル) フェニル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

5 - シクロプロピル - 1 - (3 - (t - 3 - (6 , 6 - ジメチル - 5 , 6 - ジヒドロシ
クロペンタ [c] ピラゾール - 1 (4 H) - イル) シクロヘキシル) フェニル) - 1 H -
ピラゾール - 4 - カルボン酸 (トランスラセミ) ;

5 - シクロプロピル - 1 - (3 - (- 3 - (6 , 6 - ジメチル - 5 , 6 - ジヒドロシ
クロペンタ [c] ピラゾール - 1 (4 H) - イル) シクロヘキシル) フェニル) - 1 H - ピ
ラゾール - 4 - カルボン酸 (シスラセミ化合物) ;

5 - シクロプロピル - 1 - { 3 - [3 - (3 - メチル - ピペリジン - 1 - カルボニル)
- シクロヘキシル] - フェニル } - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

1 - (3 - (1 - (t e r t - プトキシカルボニル) ピペリジン - 3 - イル) フェニル
)- 5 - ((1 R , 2 R) - 2 - (1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4
- イル) シクロプロピル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

1 - (3 - (1 - (t e r t - プトキシカルボニル) ピペリジン - 3 - イル) フェニル
)- 5 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

1 - (3 - (1 - (シクロヘキシルメチル) ピペリジン - 3 - イル) フェニル) - 5 -
シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸、塩酸塩 ;

5 - ((1 R , 2 R) - 2 - (1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イ
ル) シクロプロピル) - 1 - (3 - (1 - フェネチルピペリジン - 3 - イル) フェニル)
- 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸、塩酸塩 ;

5 - ((1 R , 2 R) - 2 - (1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イ
ル) シクロプロピル) - 1 - (3 - (1 - (フェニルスルホニル) ピペリジン - 3 - イル)
フェニル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

1 - (3 - (1 - (2 - シクロヘキシルアセチル) ピペリジン - 3 - イル) フェニル)
- 5 - ((1 R , 2 R) - 2 - (1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イ
ル) シクロプロピル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

5 - ((1 R , 2 R) - 2 - (1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イ
ル) シクロプロピル) - 1 - (3 - (1 - ピバロイルピペリジン - 3 - イル) フェニル)
- 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

1 - (3 - (1 - ベンゾイルピペリジン - 3 - イル) フェニル) - 5 - ((1 R , 2 R)
- 2 - (1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) シクロプロピル)
- 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

5 - ((1 R , 2 R) - 2 - (1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イ
ル) シクロプロピル) - 1 - (3 - (1 - ((R) - 2 - プロピルピペリジン - 1 - カル
ボニル) ピペリジン - 3 - イル) フェニル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

1 - (3 - (3 - (2 - シクロヘキシルエチル) ピペリジン - 1 - イル) フェニル)
- 5 - ((1 R , 2 R) - 2 - (1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル)
シクロプロピル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

1 - (3 - ((S) - 3 - (2 - シクロヘキシルエチル) ピペリジン - 1 - イル) フ
ェニル) - 5 - ((1 R , 2 R) - 2 - (1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール -
4 - イル) シクロプロピル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

1 - (3 - ((R) - 3 - (2 - シクロヘキシリエチル) ピペリジン - 1 - イル) フェニル) - 5 - ((1 R , 2 R) - 2 - (1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) シクロプロピル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

1 - (3 - ((1 R , 3 S) - 3 - (6 - ブチル - 5 , 6 - ジヒドロシクロペンタ [c] ピラゾール - 1 (4 H) - イル) シクロヘキシリル) フェニル) - 5 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

1 - (3 - ((1 , 3 - トランス) - 3 - (6 - ブチル - 5 , 6 - ジヒドロシクロペンタ [c] ピラゾール - 1 (4 H) - イル) シクロヘキシリル) フェニル) - 5 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

1 - (3 - ((1 , 3 - シス) - 3 - (6 , 6 - ジメチル - 5 , 6 - ジヒドロシクロペンタ [c] ピラゾール - 1 (4 H) - イル) シクロヘキシリル) フェニル) - 5 - (2 - (1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) シクロプロピル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

1 - (3 - ((1 , 3 - トランス) - 3 - (6 , 6 - ジメチル - 5 , 6 - ジヒドロシクロペンタ [c] ピラゾール - 1 (4 H) - イル) シクロヘキシリル) フェニル) - 5 - (2 - (1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) シクロプロピル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

1 - (3 - (3 - ((2 - ブチルシクロペンチル) (メチル) カルバモイル) シクロヘキシリル) フェニル) - 5 - シクロプロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ;

1 - (3 - (3 - (2 - ブチルピロリジン - 1 - カルボニル) シクロヘキシリル) フェニル) - 5 - (2 - (1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) シクロプロピル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 ; および

1 - (3 - ((R) - 3 - (シクロヘキシリメトキシ) ピペリジン - 1 - イル) フェニル) - 5 - ((1 R , 2 R) - 2 - (1 - メチル - 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - イル) シクロプロピル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸

から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物と、薬学上許容可能な担体または賦形剤とを含んでなる、医薬組成物。

【請求項 5】

C O P D 、喘息、線維症、慢性喘息および急性喘息、環境暴露続発性肺疾患、急性肺感染、慢性肺感染、1アンチトリプシン疾患、囊胞性線維症、自己免疫疾患、糖尿病性腎症、慢性腎疾患、敗血症誘発性急性腎傷害、急性腎傷害 (A K I) 、腎移植の際に見られる腎疾患または機能不全、肺動脈性高血圧症、アテローム性動脈硬化症、高血圧症、心不全、パーキンソン病 (P D) 、アルツハイマー病 (A D) 、フリードライビ運動失調症 (F A) 、筋萎縮性側索硬化症 (A L S) 、多発性硬化症 (M S) 、炎症性腸疾患、結腸癌、新生血管 (萎縮型) A M D および新生血管 (渗出型) A M D 、眼外傷、フックス角膜内皮変性症 (F E C D) 、ブドウ膜炎または他の炎症性眼病態、非アルコール性脂肪性肝炎 (N A S H) 、毒素誘発性肝疾患 (例えば、アセトアミノフェン誘発性肝疾患) 、ウイルス性肝炎、硬変、乾癬、皮膚炎 / 放射線の局所的影響、放射線被曝による免疫抑制、子白前症、および高所病を含む、呼吸器系および非呼吸器系障害を治療するための医薬組成物であって、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物を含んでなる、医薬組成物。

【請求項 6】

経口投与のための、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

静脈内投与のための、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

吸入による投与のための、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記疾患が C O P D である、請求項 5 に記載の医薬組成物。