

【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9月19日(2019.9.19)

【公表番号】特表2018-528270(P2018-528270A)

【公表日】平成30年9月27日(2018.9.27)

【年通号数】公開・登録公報2018-037

【出願番号】特願2018-532811(P2018-532811)

【国際特許分類】

| | |
|----------------|-----------|
| C 07 D 405/06 | (2006.01) |
| C 07 D 405/14 | (2006.01) |
| C 07 D 417/14 | (2006.01) |
| C 07 D 413/14 | (2006.01) |
| A 61 K 31/4545 | (2006.01) |
| A 61 P 43/00 | (2006.01) |
| A 61 P 17/00 | (2006.01) |
| A 61 P 17/04 | (2006.01) |
| A 61 P 17/06 | (2006.01) |
| A 61 P 29/00 | (2006.01) |
| A 61 P 37/08 | (2006.01) |
| C 07 D 213/79 | (2006.01) |
| C 07 D 401/12 | (2006.01) |
| C 07 D 211/42 | (2006.01) |
| C 07 D 211/56 | (2006.01) |
| C 07 C 233/18 | (2006.01) |

【F I】

| | |
|----------------|-------|
| C 07 D 405/06 | |
| C 07 D 405/14 | C S P |
| C 07 D 417/14 | |
| C 07 D 413/14 | |
| A 61 K 31/4545 | |
| A 61 P 43/00 | 1 1 1 |
| A 61 P 17/00 | |
| A 61 P 17/04 | |
| A 61 P 17/06 | |
| A 61 P 29/00 | |
| A 61 P 37/08 | |
| C 07 D 213/79 | |
| C 07 D 401/12 | |
| C 07 D 211/42 | |
| C 07 D 211/56 | |
| C 07 C 233/18 | |

【手続補正書】

【提出日】令和1年8月6日(2019.8.6)

【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

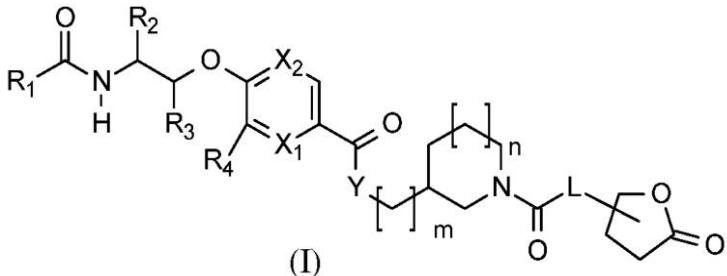
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



[式中、

R_1 は、5および6員ヘテロアリール、($C_1 \sim C_6$)アルキル、($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、(4～6)員ヘテロシクロアルキルおよびフェニルからなる群から選択され、ここで、当該5および6員ヘテロアリール、($C_1 \sim C_6$)アルキル、($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、(4～6)員ヘテロシクロアルキルおよびフェニルは、($C_1 \sim C_4$)アルキル、($C_1 \sim C_4$)アルコキシ、ハロゲン、ヒドロキシルおよびシアノから独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく；

R_2 は、($C_1 \sim C_3$)アルキルおよびハロ($C_1 \sim C_3$)アルキルから選択され；

R_3 は、フェニル、5員ヘテロアリールおよび6員ヘテロアリールから選択され、ここで、当該フェニル、5員ヘテロアリールおよび6員ヘテロアリールは、 R_5 から独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく；

R_4 は、水素、ハロゲン、($C_1 \sim C_4$)アルキルおよびハロ($C_1 \sim C_4$)アルキルから選択され；

R_5 は、ハロゲン、シアノ、($C_1 \sim C_6$)アルキル、($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、ヒドロキシ($C_1 \sim C_6$)アルキル、フェニル、5員ヘテロアリール、6員ヘテロアリールおよび- $S(O)_2$ R_a から選択され、ここで、 R_a は、($C_1 \sim C_4$)アルキルを表し；

X_1 は、CH、 $C(R_b)$ およびNから選択され、ここで、 R_b は、ハロゲン、($C_1 \sim C_4$)アルキルまたはハロ($C_1 \sim C_4$)アルキルを表し；

X_2 は、CHおよびNから選択され；

Yは、-NH-および-O-から選択され；

mは、0または1であり；nは、0または1であり；

Lは、結合、-O-、-NH-または-N(R_c)-を表し、ここで、 R_c は、($C_1 \sim C_4$)アルキルを表す]

で示される化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物もしくは溶媒和物。

【請求項2】

R_1 が、5員ヘテロアリール、($C_1 \sim C_6$)アルキル、($C_3 \sim C_6$)シクロアルキルおよび(4～6)員ヘテロシクロアルキルからなる群から選択され、ここで、当該5員ヘテロアリール、($C_1 \sim C_6$)アルキル、($C_3 \sim C_6$)シクロアルキルおよび(4～6)員ヘテロシクロアルキルが、($C_1 \sim C_4$)アルキル、($C_1 \sim C_4$)アルコキシ、ハロゲンおよびヒドロキシルから独立して選択される1個以上の置換基で置換されていてもよい、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

R_2 が($C_1 \sim C_3$)アルキルである、請求項1～2いずれか1項記載の化合物。

【請求項4】

R_3 が、ハロゲン、($C_1 \sim C_6$)アルキル、($C_3 \sim C_6$)シクロアルキルおよびフェニルから独立して選択される1個以上の置換基で置換されているフェニルである、請求項1～3いずれか1項記載の化合物。

【請求項 5】

R_4 が水素である、請求項1～4いずれか1項記載の化合物。

【請求項 6】

X_1 がC HおよびNから選択される、請求項1～5いずれか1項記載の化合物。

【請求項 7】

X_2 がC Hである、請求項1～6いずれか1項記載の化合物。

【請求項 8】

下記のものから選択される請求項1～7いずれか1項記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物もしくは溶媒和物：

N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (2, 2 - ジフルオロプロパノイルアミノ)プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(1S, 2R) - 2 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - メチル - 2 - [[6 - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]カルバモイル] - 3 - ピリジル]オキシ]エチル]イソチアゾール - 3 - カルボキサミド、

N - [(1S, 2R) - 2 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - メチル - 2 - [[6 - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]カルバモイル] - 3 - ピリジル]オキシ]エチル]イソチアゾール - 5 - カルボキサミド、

N - [(1S, 2R) - 2 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - メチル - 2 - [[6 - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]カルバモイル] - 3 - ピリジル]オキシ]エチル]オキサゾール - 2 - カルボキサミド、

N - [(1S, 2R) - 2 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - メチル - 2 - [[6 - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]カルバモイル] - 3 - ピリジル]オキシ]エチル]チアゾール - 4 - カルボキサミド、

N - [(1S, 2R) - 2 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - メチル - 2 - [[6 - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]カルバモイル] - 3 - ピリジル]オキシ]エチル] - 3 - メチル - イソオキサゾール - 5 - カルボキサミド、

N - [(1S, 2R) - 2 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - メチル - 2 - [[6 - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]カルバモイル] - 3 - ピリジル]オキシ]エチル]オキサゾール - 5 - カルボキサミド、

5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [[(2S) - 2 - ヒドロキシブタノイル]アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [[(2R) - 2 - ヒドロキシプロパノイル]アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(1S, 2R) - 2 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - メチル - 2 - [[6 - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]カルバモイル] - 3 - ピリジル]オキシ]エチル]イソオキサゾール - 5 - カルボキサミド、

5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [[(2R) - 2 - ヒドロキ

シブタノイル]アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、
 5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 - メトキシアセチル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、
 5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 - ヒドロキシ - 2 - メチル - プロパノイル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、
 5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (3 - ヒドロキシプロパノイルアミノ)プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、
 5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(1 - ヒドロキシシクロブタンカルボニル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、
 5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(1 - ヒドロキシシクロプロパンカルボニル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、
 N - [(1S, 2R) - 2 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - メチル - 2 - [[6 - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]カルバモイル] - 3 - ピリジル]オキシ]エチル]オキサゾール - 4 - カルボキサミド、
 5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [[(2S) - テトラヒドロフラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、
 5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 - ヒドロキシアセチル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、
 5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [[(2R) - テトラヒドロフラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、
 N - [(1S, 2R) - 2 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - メチル - 2 - [[6 - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]カルバモイル] - 3 - ピリジル]オキシ]エチル]イソオキサゾール - 3 - カルボキサミド、
 4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
 4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (1, 2, 5 - チアジアゾール - 3 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
 4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(5 - メチルチアゾール - 2 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
 4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (チアゾール - 5 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
 4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(4 - メチル - 1, 2, 5 - オキサジアゾール - 3 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R , 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(5 - メチルチアゾール - 4 - カルボニル) アミノ] プロポキシ] 安息香酸 [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] 、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(4 - メチルチアゾール - 5 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(5 - メチル - 1, 3, 4 - オキサジアゾール - 2 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(4 - メチルチアシアゾール - 5 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(4 - メチルオキサゾール - 5 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 - メトキシアセチル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 - メチルピラゾール - 3 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 - メチルチアゾール - 5 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [[[2R) - テトラヒドロ
フラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキ
ソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(3 - メチルトリアゾール - 4 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (1,2,4 - オキサジアゾール - 3 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(1 - メチルイミダゾール - 2 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(3 - メチルイソオキサゾール - 5 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(5 - メチル - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(1 - メチルイミダゾール - 4 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (イソチアゾール - 3 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(3 - メチルイソオキサゾール - 4 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキ

ソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]、
4-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-(チアゾール-2-カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]、
4-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-(イソチアゾール-5-カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]、
4-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-[(5-メチルイソチアゾール-4-カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]、
4-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-(オキサゾール-2-カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]、
4-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-(オキサゾール-5-カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]、
4-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-(イソオキサゾール-3-カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]、
4-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-(チアジアゾール-4-カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]、
4-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-[(5-メチルイソオキサゾール-3-カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]、
4-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-(イソオキサゾール-5-カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]、
4-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-(チアゾール-4-カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]、
4-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-[(3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]、
4-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-[(1-メチルピラゾール-3-カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]、
4-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-(2,2-ジフルオロプロパノイルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]、
N-[(3R)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]-5-[(1R,2S)-1-(p-トリル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-2-カルボキサミド、
N-[(3R)-1-[(3S)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]-5-[(1R,2S)-1-(p-トリル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-2-カルボキサミド、
N-[(3R)-1-[(2S)-5-オキソテトラヒドロフラン-2-カルボニル]-3-ピペリジル]-5-[(1R,2S)-1-(p-トリル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-2-カルボキサミド、
N-[(3R)-1-[(2R)-5-オキソテトラヒドロフラン-2-カルボニル]-3-

ピペリジル] - 5 - [(1R,2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3S) - 1 - [(3S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1R,2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3S) - 1 - [(2S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 2 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1R,2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3R) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル]ピロリジン - 3 - イル] - 5 - [(1R,2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1R,2S) - 1 - (4 - エチルフェニル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1R,2S) - 1 - (4 - プロモフェニル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1R,2S) - 1 - (4 - フェニルフェニル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 4 - [(1R,2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ベンズアミド、

4 - [(1R,2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

N - [(3S) - 1 - [(3S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル]カルバモイル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1R,2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル]カルバモイル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1R,2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

(3S) - 3 - [[5 - [(1R,2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボニル]アミノ]ピペリジン - 1 - カルボン酸[(3S) - 2 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル]、

(3S) - 3 - [[5 - [(1R,2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボニル]アミノ]ピペリジン - 1 - カルボン酸[(3R) - 2 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル]、

(3S) - 3 - [[5 - [(1R,2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボニル]アミノ]ピペリジン - 1 - カルボン酸[(3S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル]、

(3S) - 3 - [[5 - [(1R,2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボニル]アミノ]ピペリジン - 1 - カルボン酸[(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル]、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロビルフェニル) - 2 - [(2R) - テトラヒドロフラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロビルフェニル) - 2 - [(2S) - テトラヒドロフラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 R) - テトラヒドロフラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

N - [(3 S) - 1 - [(3 S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1 S, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミドおよび

N - [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1 S, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド。

【請求項 9】

請求項 1 ~ 8 いずれか 1 項記載の化合物を含む、医薬。

【請求項 10】

請求項 1 ~ 8 いずれか 1 項記載の化合物、および薬学的に許容されるビヒクルもしくは賦形剤または薬学的に許容される担体を含む、医薬組成物。

【請求項 11】

炎症性、アレルギー性または増殖性の皮膚科の疾患または状態の予防、処置または寛解に用いるための、請求項 9 記載の医薬または請求項 10 記載の医薬組成物。

【請求項 12】

疾患または状態が、アトピー性皮膚炎、乾癬または湿疹である、請求項 11 記載の医薬または医薬組成物。

【請求項 13】

さらに、1種類以上の他の治療活性化合物を含む、請求項 12 記載の医薬または医薬組成物。

【請求項 14】

グルココルチコイド受容体のミュレーションに反応性である疾患、障害または状態の処置に用いるための、請求項 9 記載の医薬または請求項 10 記載の医薬組成物。

【請求項 15】

下記のものから選択される化合物：

5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボン酸、

5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - エチルフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボン酸、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]安息香酸、

5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - プロモフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボン酸、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - プロモフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]安息香酸および

5 - [(1 S, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボン酸。

【請求項 16】

下記のものから選択される化合物：

N - [(3 S) - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3 R) - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - エチルフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3 S) - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド

、

5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオ

ロアセチル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2R) - テトラヒドロフラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(1S, 2R) - 2 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - メチル - 2 - [(6 - [(3S) - 3 - ピペリジル]カルバモイル] - 3 - ピリジル]オキシ]エチル]イソオキサゾール - 3 - カルボキサミド、

5 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3R) - ピロリジン - 3 - イル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - ブロモフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3S) - 3 - ピペリジル] - 4 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ベンズアミド、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2S) - テトラヒドロフラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 3 - ピペリジル]・塩酸塩および

(3S) - 3 - [[5 - [(1S, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボニル]アミノ]ピペリジン - 1 - カルボン酸tert - ブチル。

【請求項 17】

下記のものから選択される化合物：

(3S) - 3 - [[5 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボニル]アミノ]ピペリジン - 1 - カルボン酸tert - ブチル、

(3S) - 3 - [[5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - ブロモフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボニル]アミノ]ピペリジン - 1 - カルボン酸tert - ブチル、

(3S) - 3 - [[5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボニル]アミノ]ピペリジン - 1 - カルボン酸tert - ブチル、

(3S) - 3 - [[5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2R) - テトラヒドロフラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボニル]アミノ]ピペリジン - 1 - カルボン酸tert - ブチル、

(3S) - 3 - [[5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (イソオキサゾール - 3 - カルボニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボニル]アミノ]ピペリジン - 1 - カルボン酸tert - ブチル、

(3S) - 3 - [4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - ブロモフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ベンゾイル]オキシピペリジン - 1 - カルボン酸tert - ブチル、

(3S) - 3 - [4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ベンゾイル]オキシピペリジン - 1 - カルボン酸tert - ブチル、

(3R) - 3 - [[5 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボニル]アミノ]ピロリジン - 1 - カルボン酸tert - ブチル、

(3S) - 3 - [[4 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロ

アセチル)アミノ]プロポキシ]ベンゾイル]アミノ]ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルおよび

(3S)-3-[4-[(1R,2S)-1-(p-トリル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ベンゾイル]オキシピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルおよび

(3S)-3-[[5-[(1S,2S)-1-(p-トリル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-2-カルボニル]アミノ]ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチル。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0058

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0058】

本発明の実施態様は、

N-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]-5-[(1R,2S)-1-(p-トリル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-2-カルボキサミド、

5-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]-N-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]ピリジン-2-カルボキサミド、

5-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-(2,2-ジフルオロプロパノイルアミノ)プロポキシ]-N-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]ピリジン-2-カルボキサミド、

N-[(1S,2R)-2-(4-シクロプロピルフェニル)-1-メチル-2-[[6-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]カルバモイル]-3-ピリジル]オキシ]エチル]イソチアゾール-3-カルボキサミド、

N-[(1S,2R)-2-(4-シクロプロピルフェニル)-1-メチル-2-[[6-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]カルバモイル]-3-ピリジル]オキシ]エチル]オキサゾール-2-カルボキサミド、

N-[(1S,2R)-2-(4-シクロプロピルフェニル)-1-メチル-2-[[6-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]カルバモイル]-3-ピリジル]オキシ]エチル]チアゾール-4-カルボキサミド、

N-[(1S,2R)-2-(4-シクロプロピルフェニル)-1-メチル-2-[[6-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]カルバモイル]-3-ピリジル]オキシ]エチル]-3-メチル-イソオキサゾール-5-カルボキサミド、

N-[(1S,2R)-2-(4-シクロプロピルフェニル)-1-メチル-2-[[6-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]カルバモイル]-3-ピリジル]オキシ]エチル]オキサゾール-5-カルボキサミド、

5-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-[(2S)-2-ヒドロキシブタノイル]アミノ]プロポキシ]-N-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]ピリジン-2-カルボキサミド、

5-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-[(2R)-2-ヒドロキシプロパノイル]アミノ]プロポキシ]-N-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒ

ドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、
 N - [(1S,2R) - 2 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - メチル - 2 - [[6 - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]カルバモイル] - 3 - ピペリジル]オキシ]エチル]イソオキサゾール - 5 - カルボキサミド、

5 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2R) - 2 - ヒドロキシブタノイル]アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 - メトキシアセチル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 - ヒドロキシ - 2 - メチル - プロパノイル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (3 - ヒドロキシプロパノイルアミノ)プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(1 - ヒドロキシシクロブタンカルボニル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(1 - ヒドロキシシクロプロパンカルボニル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(1S,2R) - 2 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - メチル - 2 - [[6 - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]カルバモイル] - 3 - ピリジル]オキシ]エチル]オキサゾール - 4 - カルボキサミド、

5 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2S) - テトラヒドロフラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2R) - テトラヒドロフラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ] - N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(1S,2R) - 2 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - メチル - 2 - [[6 - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]カルバモイル] - 3 - ピリジル]オキシ]エチル]イソオキサゾール - 3 - カルボキサミド、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2,2,2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (1,2,5 - チアジアゾール - 3 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(5 - メチルチアゾール - 2 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (チアゾール - 5 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(4 - メチル - 1, 2, 5 - オキサジアゾール - 3 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R , 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(5 - メチルチアゾール - 4 - カルボニル) アミノ] プロポキシ] 安息香酸 [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] 、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(4 - メチルチアゾール - 5 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(5 - メチル - 1, 3, 4 - オキサジアゾール - 2 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R , 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(4 - メチルチアジアゾール - 5 - カルボニル) アミノ] プロポキシ] 安息香酸 [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] 、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(4 - メチルオキサゾール - 5 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 - メトキシアセチル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]。

4 - [(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-[(2-メチルピラゾール-3-カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ペペリジル]

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 - メチルチアゾール - 5 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 R) - テトラヒドロ
フラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキ
ソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(3 - メチルトリアゾール - 4 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソトリアヒドロフラン - 3 - カルボニル - 2 - ピペリジル]

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(1 - メチルイミダゾール - 2 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ヒペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(3 - メチルイソオキサゾール - 5 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキシエチルカルボニル] - 2 - カルボニル] - 3 - オキシカルボニル]

ソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ヒペリシル]、
 4-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-[(5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(1 - メチルイミダゾール - 4 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸 [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ヒペリシル]、

トラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (イソチアゾール - 3 -
カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロ
フラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(3 - メチルイソオキサ
ゾール - 4 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキ
ソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (チアゾール - 2 - カル
ボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフ
ラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (イソチアゾール - 5 -
カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフ
ラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(5 - メチルイソチアゾ
ール - 4 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソ
テトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (オキサゾール - 2 - カ
ルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフ
ラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (オキサゾール - 5 - カ
ルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフ
ラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (チアジアゾール - 4 -
カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフ
ラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(5 - メチルイソオキサ
ゾール - 3 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキ
ソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (イソオキサゾール - 5
- カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒド
ロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (チアゾール - 4 - カル
ボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフ
ラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(3 - メチル - 1, 2, 4
- オキサジアゾール - 5 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R)
- 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(1 - メチルピラゾール
- 3 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテ
トラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (2, 2 - ジフルオロプロ
パノイルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフ
ラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、
N - [(3 R) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 -
ピペリジル] - 5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロア
セチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、
N - [(3 R) - 1 - [(3 S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 -

ピペリジル] - 5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3R) - 1 - [(2S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 2 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3R) - 1 - [(2R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 2 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3S) - 1 - [(3S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3S) - 1 - [(2S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 2 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3R) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル]ピロリジン - 3 - イル] - 5 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1R,2S)-1-(4-エチルフェニル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]-N-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]ピリジン-2-カルボキサミド、

5 - [(1R,2S)-1-(4-プロモフェニル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]-N-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]ピリジン-2-カルボキサミド、

N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - フェニルフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 4 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ベンズアミド、

4 - [(1R,2S)-1-(p-トリル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]、

N - [(3 S) - 1 - [(3 S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル]カルバモイル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル]カルバモイル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

(3S)-3-[[5-[(1R,2S)-1-(p-トリル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-2-カルボニル]アミノ]ピペリジン-1-カルボン酸[(3S)-2-オキソテトラヒドロフラン-3-イル]、

(3S)-3-[(5-[(1R,2S)-1-(p-トリル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-2-カルボニル]アミノ]ピペリジン-1-カルボン酸[(3R)-2-オキソテトラヒドロフラン-3-イル]、

(3S)-3-[(5-[(1R,2S)-1-(p-トリル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-2-カルボニル]アミノ]ピペリジン-1-カルボン酸[(3S)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-イル]または

(3S)-3-[(5-[(1R,2S)-1-(p-トリル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-2-カルボニル]アミノ]ピペリジン-1-カルボン酸[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-イル]

から選択される式(Ⅰ)で示される化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物もしくは溶媒和物を提供する。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0313

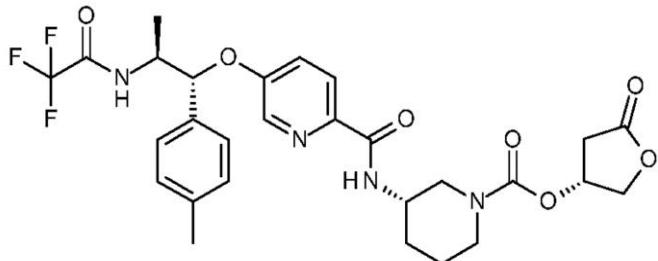
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0313】

実施例76:
 $(3S)-3-[(5-[(1R,2S)-1-(p-トリル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-2-カルボニル]アミノ]ピペリジン-1-カルボン酸[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-イル]$ (化合物76)

【化106】



(3S)-3-ヒドロキシ-テトラヒドロフラン-2-オンの代わりに(4R)-4-ヒドロキシ-テトラヒドロフラン-2-オンを使用した以外は実施例73について記載した手順と同様の手順を使用して、標記化合物を非晶質固体として製造した。

UPLC-MS方法2: 質量イオン 592.21 (M^+)、 $R_t = 2.37$ 分

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0357

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0357】

実施態様32. 下記のものから選択される、実施態様1~31のいずれか1つに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、水和物もしくは溶媒和物:

$N-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]-5-[(1R,2S)-1-(p-トリル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-2-カルボキサミド$ 、

$5-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]-N-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]ピリジン-2-カルボキサミド$ 、

$5-[(1R,2S)-1-(4-シクロプロピルフェニル)-2-(2,2-ジフルオロプロパノイルアミノ)プロポキシ]-N-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]ピリジン-2-カルボキサミド$ 、

$N-[(1S,2R)-2-(4-シクロプロピルフェニル)-1-メチル-2-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]カルバモイル]-3-ピリジル]オキシエチル]イソチアゾール-3-カルボキサミド$ 、

$N-[(1S,2R)-2-(4-シクロプロピルフェニル)-1-メチル-2-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]カルバモイル]-3-ピリジル]オキシエチル]イソチアゾール-5-カルボキサミド$ 、

$N-[(1S,2R)-2-(4-シクロプロピルフェニル)-1-メチル-2-[(6-[(3S)-1-[(3R)-5-オキソテトラヒドロフラン-3-カルボニル]-3-ピペリジル]カルバモイル]-3-ピリジル]オキシエチル]イソチアゾール-5-カルボキサミド$ 、

5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 R) - テトラヒドロフラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ] - N - [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(1 S, 2 R) - 2 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 1 - メチル - 2 - [6 - [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]カルバモイル] - 3 - ピリジル]オキシ]エチル]イソオキサゾール - 3 - カルボキサミド、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (1, 2, 5 - チアジアゾール - 3 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(5 - メチルチアゾール - 2 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (チアゾール - 5 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(4 - メチル - 1, 2, 5 - オキサジアゾール - 3 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(5 - メチルチアゾール - 4 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(4 - メチルチアゾール - 5 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(5 - メチル - 1, 3, 4 - オキサジアゾール - 2 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(4 - メチルチアジアゾール - 5 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(4 - メチルオキサゾール - 5 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 - メトキシアセチル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 - メチルピラゾール - 3 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 - メチルチアゾール - 5 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(2 R) - テトラヒドロフラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(3 - メチルトリアゾール - 4 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R , 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - カルボニルアミノ) プロポキシ] 安息香酸 [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキシテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] 、

4 - [(1 R , 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(1 - メチルイミダゾール - 2 - カルボニル) アミノ] プロポキシ] 安息香酸 [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] 、

4 - [(1 R , 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(3 - メチルイソオキサゾール - 5 - カルボニル) アミノ] プロポキシ] 安息香酸 [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] 、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(5 - メチル - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R , 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(1 - メチルイミダゾール - 4 - カルボニル) アミノ] プロポキシ] 安息香酸 [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] 、

4 - [(1 R , 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (イソチアゾール - 3 - カルボニルアミノ) プロポキシ] 安息香酸 [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] 、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(3 - メチルイソオキサゾール - 4 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]。

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (チアゾール - 2 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (イソチアゾール - 5 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]。

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(5 - メチルイソチアゾール - 4 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソエトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]

4 - [(1R,2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (オキサゾール - 2 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (オキサゾール - 5 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (イソオキサゾール - 3 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル - 3 - ピペリジル]

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (チアジアゾール - 4 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 2 - カルボニル - 2 - ペペリジル]

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(5 - メチルイソオキサゾール - 3 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソエチテヒドロフラン - 2 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (イソオキサゾール - 5 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸 [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒド

ロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (チアゾール - 4 - カルボニルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(3 - メチル - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 5 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [(1 - メチルピラゾール - 3 - カルボニル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - (2, 2 - ジフルオロプロパノイルアミノ)プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

N - [(3 R) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3 R) - 1 - [(3 S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3 R) - 1 - [(2 S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 2 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3 R) - 1 - [(2 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 2 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3 S) - 1 - [(3 S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3 S) - 1 - [(2 S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 2 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3 R) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル]ピロリジン - 3 - イル] - 5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - エチルフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - プロモフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ] - N - [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1 R, 2 S) - 1 - (4 - フェニルフェニル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ベンズアミド、

4 - [(1 R, 2 S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3 S) - 1 - [(3 R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

N - [(3 S) - 1 - [(3 S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル]カルバモイル

] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

N - [(3S) - 1 - [[(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル]カルバモイル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド、

(3S) - 3 - [[5 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボニル]アミノ]ピペリジン - 1 - カルボン酸[(3S) - 2 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル]、

(3S) - 3 - [[5 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボニル]アミノ]ピペリジン - 1 - カルボン酸[(3R) - 2 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル]、

(3S) - 3 - [[5 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボニル]アミノ]ピペリジン - 1 - カルボン酸[(3S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル]、

(3S) - 3 - [[5 - [(1R, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボニル]アミノ]ピペリジン - 1 - カルボン酸[(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - イル]、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [[(2R) - テトラヒドロフラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [[(2S) - テトラヒドロフラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

4 - [(1R, 2S) - 1 - (4 - シクロプロピルフェニル) - 2 - [[(2R) - テトラヒドロフラン - 2 - カルボニル]アミノ]プロポキシ]安息香酸[(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル]、

N - [(3S) - 1 - [(3S) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1S, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミドまたは

N - [(3S) - 1 - [(3R) - 5 - オキソテトラヒドロフラン - 3 - カルボニル] - 3 - ピペリジル] - 5 - [(1S, 2S) - 1 - (p - トリル) - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロアセチル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 2 - カルボキサミド。