

【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24年2月2日 (2012.2.2)

【公表番号】特表2011-507915(P2011-507915A)

【公表日】平成23年3月10日 (2011.3.10)

【年通号数】公開・登録公報2011-010

【出願番号】特願2010-540046(P2010-540046)

【国際特許分類】

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 403/12 C S P

A 6 1 K 31/496

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 413/14

C 0 7 D 403/14

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/04

【手続補正書】

【提出日】平成23年12月7日 (2011.12.7)

【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】

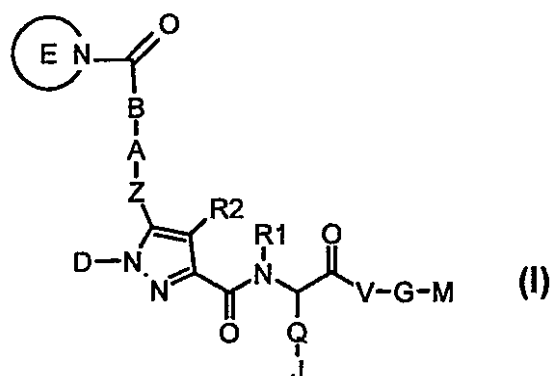
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

すべての下記化合物の立体異性体形態及びその任意の比率の混合物を包含する、式 I

:

【化 1】



{ 式中、

E は、

アゼチジン、ピペラジン、ピペリジン又はピロリジンから選択される 3 ~ 10 員のヘテロサイクリック残基 [ここで、該ヘテロサイクリック残基は、その窒素原子によってカルボニル炭素原子と結合し、そしてここで該ヘテロサイクリック残基は、非置換であるか、又は R 3 によって、互いに独立して、一若しくは二置換されている] であり、

D は、

フェニル [ここで、フェニルは、非置換であるか、又は R 4 によって、1 回若しくは 2 回置換されている] であり、

Q は、

1) 共有結合、

2) - (C₀ - C₄) - アルキレン - O - 、

3) - (C₀ - C₄) - アルキレン - C (O) - O - (C₀ - C₄) - アルキレン - 、

4) - (C₀ - C₄) - アルキレン - NH - C (O) - (C₀ - C₂) - アルキレン - 、

5) - (C₀ - C₄) - アルキレン - NH - C (O) - O - (C₀ - C₂) - アルキレン -

6) - (C₀ - C₄) - アルキレン - NH - SO₂ - (C₀ - C₂) - アルキレン - 又は

7) - (C₃ - C₁₅) - ヘテロシクリル - [ここで、該ヘテロシクリルは、アゼチジニル、フラニル、イミダゾリル、インドリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、オキサゾリル、ピペラジニル、ピペリジニル、ピロリジニル、テトラゾリル又はチエニルから選択され、そして非置換であるか、又は R 1 4 によって互いに独立して、一、二若しくは三置換されている] であり、

J は、

1) 水素原子、

2) - (C₁ - C₆) - アルキル [ここで、アルキルは、非置換であるか、又は R 1 3 によって互いに独立して、一、二若しくは三置換されている]、

3) - (C₀ - C₄) - アルキレン - C (O) - O - R 1 1、又は

4) - (C₀ - C₄) - アルキレン - フェニル [ここで、フェニルは、非置換であるか、又は R 1 3 によって互いに独立して、一、二若しくは三置換されている] であり、

Z - A - B は、

カルボニル炭素原子と一緒に、- O - CH₂ - C (O) - 、- O - CH (CH₃) - C (O) - 又は - O - C (CH₃)₂ - C (O) - [ここで、該残基は、酸素原子を介してピラゾール残基と結合し、そしてカルボニル炭素原子によって E の窒素原子と結合する] から選択される残基を形成し、

V は、

アゼチジニル、ピペラジニル、ピペリジニル又はピロリジニルから選択されるヘテロシクリルであり、そしてこのヘテロシクリルは、非置換であるか、又は R 1 4 によって、互

いに独立して、一若しくは二置換されており、

G は、

1) 共有結合、

2) - (C₀ - C₂) - アルキレン - C (O) - 、

3) - (C₀ - C₂) - アルキレン - C (O) - O - (C₀ - C₄) - アルキレン - 、又は

4) - (C₀ - C₂) - アルキレン - N (R₁₀) - C (O) - O - (C₀ - C₄) - アルキレン - であり、

M は、

1) 水素原子、

2) - (C₁ - C₄) - アルキル [ここで、アルキルは、非置換であるか、又は R₁₄ によって互いに独立して、一、二若しくは三置換されている]、

3) - (C₃ - C₆) - シクロアルキル [ここで、該シクロアルキルは、非置換であるか、又は R₁₄ によって互いに独立して、一、二若しくは三置換されている]、又は

4) - フェニル [ここで、フェニルは、非置換であるか、又は R₁₄ によって互いに独立して、一、二若しくは三置換されている] であり、

R₁ 及び R₂ は、

それぞれ、水素原子であり、

R₃ は、

1) 水素原子、

2) ハロゲン、

3) - (C₁ - C₆) - アルキル [ここで、アルキルは、非置換であるか、又は R₁₃ によって互いに独立して、一、二若しくは三置換されている]、

4) = O、

5) - (C₁ - C₃) - フルオロアルキル、

6) - (C₀ - C₄) - アルキレン - OH、

7) - (C₀ - C₄) - アルキレン - C (O) - R₁₁、

8) - (C₀ - C₄) - アルキレン - C (O) - O - R₁₁、

9) - (C₀ - C₄) - アルキレン - C (O) - N (R₁₁) - R₁₂、

10) - (C₀ - C₄) - アルキレン - C (O) - N (R₁₁) - R₁₃、

11) - (C₀ - C₄) - アルキレン - N (R₁₁) - R₁₃、

12) - (C₀ - C₄) - アルキレン - SO_s - R₁₁ [ここで、s は、1 又は 2 である]、

13) - (C₀ - C₄) - アルキレン - フェニル [ここで、フェニルは、非置換であるか、又は R₁₃ によって、互いに独立して、一、二若しくは三置換されている]、又は

14) - (C₀ - C₄) - アルキレン - (C₃ - C₁₅) - ヘテロシクリル [ここで、ヘテロシクリルは、アゼチジニル、フラニル、イミダゾリル、インドリル、イソオキサゾリル、オキサジアゾリル、オキサゾリル、ピペラジニル、ピペリジニル、ピロリジニル、テトラゾリル又はチエニルから選択され、そして非置換であるか、又は R₁₃ によって互いに独立して、一、二若しくは三置換されている] であり、

R₄ は、

水素原子又はハロゲンであり、

R₁₀ は、

水素原子又は - (C₁ - C₄) - アルキルであり、

R₁₁ 及び R₁₂ は、

互いに独立して、同一又は相異なって、

1) 水素原子、

2) - (C₁ - C₄) - アルキル [ここで、アルキルは、非置換であるか、又は R₁₃ によって、互いに独立して、一若しくは二置換されている]、

3) - (C₁ - C₃) - フルオロアルキル、

4) - (C₀ - C₆) - アルキレン - (C₃ - C₈) - シクロアルキル [ここで、アルキレ

ン及びシクロアルキルは、互いに独立して、非置換であるか、又は R 1 3 によって互いに独立して、一、二若しくは三置換されている]であるか、又は

R 1 1 及び R 1 2 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、ペリジン又はピロリジンから選択されるヘテロサイクリック環を形成し、そしてここで、該環は、非置換であるか、又は R 1 3 によって、環原子の数に応じて、1、2、3 若しくは 4 回置換されており、

R 1 3 は、

ハロゲン、-OH、-(C₃-C₆)-シクロアルキル、-S-R 1 0、-C(O)-R 1 0、-(C₁-C₆)-アルキル、-(C₁-C₆)-アルコキシ又は-(C₁-C₃)-フルオロアルキルであり、そして

R 1 4 は、

-(C₁-C₄)-アルキル又は-(C₁-C₄)-アルコキシである}

式 I の化合物、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項 2】

式 I の化合物が、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロプロピルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - {(S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - オキソ - 2 - [(S) - 2 - (2, 2 - トリフルオロエチル - カルバモイル) ピロリジン - 1 - イル] - エトキシ} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル} - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - {(S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (2 - メチルスルファニル - エチルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル} - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - {(S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - ジメチルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル} - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - {(S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - シクロブチルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル} - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - {(S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (2 - フルオロ - エチルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル} - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - {(S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (2 - メチルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル} - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - {(S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - エチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル} - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - {(S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - プロピルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル} - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエ

メチル - カルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル} - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({5 - [2 - ((R) - 3 - ヒドロキシ - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({5 - [2 - ((2S, 4R) - 2 - エトキシカルボニル - 4 - ヒドロキシ - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({5 - [2 - ((S) - 2 - カルボキシ - アゼチジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({5 - [2 - ((2R, 4R) - 2 - カルボキシ - 4 - ヒドロキシ - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({5 - [2 - (4 - アセチル - ピペラジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 4 - カルボキシ - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({5 - [2 - (4 - エチル - ピペラジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({5 - [2 - (3 - アセチルアミノ - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 4 - カルボキシ - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({5 - [2 - オキソ - 2 - (3 - オキソ - ピペラジン - 1 - イル) - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - ((S) - 4 - カルボキシ - 2 - {[5 - (2 - オキソ - 2 - ピロリジン - 1 - イル - エトキシ) - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル] - アミノ} - ブチリル) - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({5 - [2 - ((S) - 2 - カルボキシ - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({5 - [2 - ((2S, 4R) - 2 - カルボキシ - 4 - ヒドロキシ - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({5 - [2 - (3 - メタンスルホニル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({5 - [2 - ((2S, 4S) - 4 - ヒドロキシ - 2 - メトキシカルボニル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - {(S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - {2 - [4 - (2 - ヒドロキシ - エチル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル} - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((3 S , 4 S) - 3 , 4 - ジヒドロキシ - ピロリジン - 1 - イル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [(R) - 2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン

- 1 - カルボン酸エチルエステル、
4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [(R) - 2 - ((S) - 2 - シクロブ
ロピルメチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - エトキシ
シ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピ
ペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、
4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { (R) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 2
- [(S) - 2 - (ピロリジン - 1 - カルボニル) - ピロリジン - 1 - イル] - エトキシ
} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - ピペ
ラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、
4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [(R) - 2 - ((S) - 2 - (2 , 2
, 2 - トリフルオロエチルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル) - 1 - メチル - 2 -
オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) -
ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、
4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [(S) - 2 - ((S) - 2 - シクロブ
ロピルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - エトキシ] -
1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジ
ン - 1 - カルボン酸エチルエステル、
4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [(S) - 2 - ((S) - 2 - シクロブ
チルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - エトキシ] - 1
- フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン
- 1 - カルボン酸エチルエステル、
4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [(S) - 2 - ((S) - 2 - シクロブ
ロピルメチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - エトキシ
シ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピ
ペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、
4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { (S) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 2
- [(S) - 2 - (ピロリジン - 1 - カルボニル) - ピロリジン - 1 - イル] - エトキシ
} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - ピペ
ラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、
4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [(S) - 2 - ((S) - 2 - (2 , 2
, 2 - トリフルオロエチルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル) - 1 - メチル - 2 -
オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) -
ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、
4 - ((S) - 4 - カルボキシ - 2 - { [5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブロピルカ
ルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - (3 - フルオロ
フェニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル] - アミノ } - ブチリル) - ピペラジン
- 1 - カルボン酸エチルエステル、
4 - ((S) - 4 - カルボキシ - 2 - { [5 - [2 - ((S) - 2 - (2 - フルオロエ
チルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - (3 - フ
ルオロ - フェニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル] - アミノ } - ブチリル) - ピ
ペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、
4 - ((S) - 4 - カルボキシ - 2 - { [5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカル
バモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - (3 - フルオロ - フ
ェニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル] - アミノ } - ブチリル) - ピペラジン -
1 - カルボン酸エチルエステル、
4 - ((S) - 4 - カルボキシ - 2 - { [5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブロピルメ
チルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - (3 - フル
オロ - フェニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル] - アミノ } - ブチリル) - ピペ
ラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、
4 - ((S) - 4 - カルボキシ - 2 - { [5 - [2 - ((S) - 2 - (2 , 2 , 2 - ト

4 - [(S) - 3 - アセチルアミノ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - プロピオニル] - ピペラジン - 1 - カルボ

4 - 「 (S) - 2 - ({ 5 - 「 2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリ

ジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 4 - イソブチリルアミノ - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

(S) - 4 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 5 - [4 - (3 - メトキシ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 5 - オキソ - ペンタン酸、

(S) - 5 - (4 - ブトキシカルボニルアミノ - ピペリジン - 1 - イル) - 4 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 5 - オキソ - ペンタン酸、

(S) - 5 - [4 - (3 - クロロ - ベンゾイル) - ピペリジン - 1 - イル] - 4 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 5 - オキソ - ペンタン酸、

(S) - 5 - (4 - ベンゾイル - ピペリジン - 1 - イル) - 4 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 5 - オキソ - ペンタン酸、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ブチリルアミノ] - ピペリジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

(S) - 5 - (4 - ベンゾイル - ピペリジン - 1 - イル) - 4 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 5 - オキソ - ペンタン酸、

3 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ブチリルアミノ] - ピロリジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

(S) - 5 - (3 - ブトキシカルボニルアミノ - ピロリジン - 1 - イル) - 4 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 5 - オキソ - ペンタン酸、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - (3 - シクロプロピルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [3 - (シクロプロピルメチル - カルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル} - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - (3 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [3 - (2, 2 - ジフルオロ - エチルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル} - ピペラジン - 1 - カル

ボン酸エチルエステル、

4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [3 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - エチルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [3 - (2 - フルオロ - エチルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 4 - ヒドロキシ - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 5 - ヒドロキシ - ペンタノイル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 4 , 5 - ジヒドロキシ - ペンタノイル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロプロピルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロプロピルメチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (2 , 2 - ジフルオロ - エチルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (2 - フルオロ - エチルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - エチルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (シクロブチル - メチル - カルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリ

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 4 - イソプロポキシカルボニル - ブチリル] - ピペラジン - 1 -

カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 4 - シクロペンチルメトキシカルボニル - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 4 - (2 , 2 - ジメチル - プロピオニルオキシメトキシカルボニル) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - ((S) - 2 - { [5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - (3 - フルオロ - フェニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ } - 4 - エトキシオキシカルボニル - ブチリル) - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - ((S) - 2 - { [5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - (3 - フルオロ - フェニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ } - 4 - イソプロポキシカルボニル - ブチリル) - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - ((S) - 2 - { [5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - (3 , 4 - ジフルオロ - フェニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ } - 4 - エトキシカルボニル - ブチリル) - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 4 - エトキシカルボニル - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

(R) - 4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - 2 - メチル - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

(R) - 4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (2 - フルオロ - エチルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - 2 - メチル - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

(R) - 4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (シクロプロピルメチル - カルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - 2 - メチル - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

(S) - 4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - 2 - メチル - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

(S) - 4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (2 - フルオロ - エチルカルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - 2 - メチル - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

(S) - 4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (シクロプロピルメチル - カルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - 2 - メチル - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

(R) - 4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブ

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカル
バモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピ
ラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸プロ

ビルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸シクロブチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - 4 , 4 - ジフルオロ - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロプロピル (proyl) カルバモイル - 4 , 4 - ジフルオロ - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - (シクロプロピル (proyl) メチル - カルバモイル) - 4 , 4 - ジフルオロ - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - オキソ - 2 - (2 - チオフェン - 2 - イル - ピロリジン - 1 - イル) - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - (2 - フラン - 2 - イル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [2 - (5 - メチル - フラン - 2 - イル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - オキソ - 2 - ((S) - 2 - フェニル - ピロリジン - 1 - イル) - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (4 - メチル - オキサゾール - 2 - イル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (4 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (3 - メチル - イソオキサゾール - 5 - イル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (3 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 5 - イル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 3 - フルオロ - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸プロピルエステル、

4 - [2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 3 - フルオロ - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 4 - カルボキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - カルボキシ - 4 , 4 - ジフルオロ - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 5 - ヒドロキシ - ペンタノイル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - ((S) - 4 - カルボキシ - 2 - { [5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル] - アミノ } - ブチリル) - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - { (S) - 4 - カルボキシ - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (3 - シクロプロピル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 5 - イル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - ブチリル } - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - アセチル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - アセチル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(R) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - プロピオニル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(R) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - プロピオニル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - プロピオニル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - プロピオニル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - { (S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 4 - [(2 , 2 - ジフルオロ - シクロプロパンカルボニル) - アミノ] - ブチリル } - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 4 - トリフルオロメタンスルホニルアミノ - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 4 - メトキシカルボニル - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸シクロブチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 4 - (テトラヒドロ - フラン - 3 - イルメトキシカルボニル) -

ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 4 - (3 - メチル - オキセタン - 3 - イルメトキシカルボニル) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 4 - (3 - エチル - オキセタン - 3 - イルメトキシカルボニル) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 4 - (3 - メトキシ - ブトキシカルボニル) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(R) - 2 - ({5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - プロピオニル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸プロピルエステル、

5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸{(R) - 2 - [4 - (3 - メトキシ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 1 - メチル - 2 - オキソ - エチル} - アミド、

4 - [(S) - 2 - ({5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - プロピオニル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸プロピルエステル、

5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸{(S) - 2 - [4 - (3 - メトキシ - フェニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 1 - メチル - 2 - オキソ - エチル} - アミド、

4 - [2 - ({5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - アセチル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸プロピルエステル、

4 - [(S) - 5 - アセトキシ - 2 - ({5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - ペンタノイル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 5 - イソブチリルオキシ - ペンタノイル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 6 - ヒドロキシ - ヘキサノイル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 6 - ヒドロキシ - ヘキサノイル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸シクロブチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カ

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カ

ルボニル } - アミノ) - 3 - ヒドロキシ - 3 - メチル - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(2 S , 3 R) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 3 - メチル - ペンタノイル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 2 - シクロプロピル - アセチル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 4 - メトキシ - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 3 - メトキシ - プロピオニル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 3 - シクロプロピル - プロピオニル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 3 - シクロブチル - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - プロピオニル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 6 - ヒドロキシ - ヘキサノイル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 6 - アセトキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ヘキサノイル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸エチルエステル、

4 - [(S) - 6 - アセトキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ヘキサノイル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 6 - アセトキシ - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ヘキサノイル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸シクロブチルエステル、

4 - { (S) - 2 - [(5 - { 2 - [(S) - 2 - (シクロブチル - メチル - カルバモイル) - ピロリジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エトキシ } - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - 6 - ヒドロキシ - ヘキサノイル } - ピペラジン - 1 - カルボン酸シクロブチルエステル、

5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 -

オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸 [2 - オキソ - 2 - (4 - ペンタノイル - ピペラジン - 1 - イル) - エチル] - アミド、

5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸 { 2 - オキソ - 2 - [4 - (3 , 3 , 3 - トリフルオロ - プロピオニル) - ピペラジン - 1 - イル] - エチル } - アミド、

5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸 [2 - (4 - シクロプロパンカルボニル - ピペラジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エチル] - アミド、

5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸 [2 - (4 - シクロブタンカルボニル - ピペラジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エチル] - アミド、

5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸 { 2 - [4 - ((1 R , 2 S) - 2 - フルオロ - シクロプロパンカルボニル) - ピペラジン - 1 - イル] - 2 - オキソ - エチル } - アミド、

5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸 { 2 - オキソ - 2 - [4 - ((1 R , 2 R) - 2 - フェニル - シクロプロパンカルボニル) - ピペラジン - 1 - イル] - エチル } - アミド、

{ 1 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 4 - メチル - ペンタノイル] - ピペリジン - 4 - イル } - カルバミン酸ブチルエステル、

{ 1 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - ペンタノイル] - ピペリジン - 4 - イル } - カルバミン酸ブチルエステル、

{ 1 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 3 - メチル - ブチリル] - ピペリジン - 4 - イル } - カルバミン酸ブチルエステル、

{ 1 - [(2 S , 3 S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 3 - メチル - ペンタノイル] - ピペリジン - 4 - イル } - カルバミン酸ブチルエステル、

{ 1 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 2 - シクロヘキシル - アセチル] - ピペリジン - 4 - イル } - カルバミン酸ブチルエステル、

{ 1 - [2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - アセチル] - ピペリジン - 4 - イル } - カルバミン酸ブチルエステル、

{ 1 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - 3 - シクロヘキシル - プロピオニル] - ピペリジン - 4 - イル } - カルバミン酸ブチルエステル、

4 - [2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル } - アミノ) - アセチル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸 2 - メトキシ - エチルエステ

4 - [2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル

} - アミノ) - アセチル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸シクロペンチルエステル、

4 - [2 - ({ 5 - [(R) - 2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 1 - メチル - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - アセチル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [2 - ({ 5 - [2 - ((2 S , 4 R) - 2 - シクロブチルカルバモイル - 4 - ヒドロキシ - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - アセチル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - { 2 - [(5 - { 2 - オキソ - 2 - [(S) - 2 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) - ピロリジン - 1 - イル] - エトキシ} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - アセチル} - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - { 2 - [(5 - { (R) - 1 - メチル - 2 - オキソ - 2 - [(S) - 2 - (1 H - テトラゾール - 5 - イル) - ピロリジン - 1 - イル] - エトキシ} - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル) - アミノ] - アセチル} - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 4 , 4 , 4 - トリフルオロ - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸プロピルエステル、

4 - [(S) - 2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - 4 , 4 , 4 - トリフルオロ - ブチリル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ブチルエステル、

4 - [2 - ({ 5 - [2 - ((S) - 2 - シクロブチルカルバモイル - ピロリジン - 1 - イル) - 2 - オキソ - エトキシ] - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニル} - アミノ) - アセチル] - ピペラジン - 1 - カルボン酸ベンジルエステル、

である、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 3】

請求項 1 又は 2 に記載の、そのすべての立体異性体形態およびその任意の比率の混合物の少なくとも一つの式 I の化合物及び / 又はその生理学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体を含んでなる、医薬製剤。