

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成18年1月12日(2006.1.12)

【公表番号】特表2005-528325(P2005-528325A)

【公表日】平成17年9月22日(2005.9.22)

【年通号数】公開・登録公報2005-037

【出願番号】特願2003-530682(P2003-530682)

【国際特許分類】

C 07 D 401/04 (2006.01)
A 61 K 31/4439 (2006.01)
A 61 K 31/444 (2006.01)
A 61 K 31/4545 (2006.01)
A 61 K 31/506 (2006.01)
A 61 K 31/5377 (2006.01)
A 61 P 5/38 (2006.01)
A 61 P 9/12 (2006.01)
A 61 P 13/08 (2006.01)
A 61 P 15/00 (2006.01)
A 61 P 31/10 (2006.01)
A 61 P 35/00 (2006.01)
A 61 P 43/00 (2006.01)
C 07 D 401/14 (2006.01)
C 07 D 405/14 (2006.01)
C 07 D 409/14 (2006.01)

【F I】

C 07 D 401/04 C S P
A 61 K 31/4439
A 61 K 31/444
A 61 K 31/4545
A 61 K 31/506
A 61 K 31/5377
A 61 P 5/38
A 61 P 9/12
A 61 P 13/08
A 61 P 15/00
A 61 P 31/10
A 61 P 35/00
A 61 P 43/00 1 1 1
C 07 D 401/14
C 07 D 405/14
C 07 D 409/14

【手続補正書】

【提出日】平成17年9月21日(2005.9.21)

【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

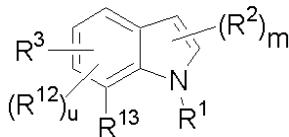
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

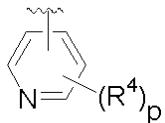
【請求項 1】

式

【化 1】

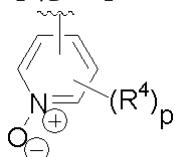
式中、R¹は、

【化 2】

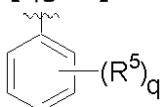


〔式中、R⁴はC₁～₄アルキルを表し；そして、
pは0、1または2である〕；

【化 3】

〔但し、R³はピリジルまたはN-オキシド-含有基以外である〕；または

【化 4】



〔式中、R⁵は、CN、ハロゲン、CHOまたはC(O)N(R⁶)₂（式中、R⁶はHまたはC₁～₄アルキルを表す）を表し；そして、

qは0、1または2である〕

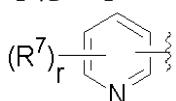
を表し；

R²はC₁～₄アルキルを表し；そして、

mは0、1または2であり；

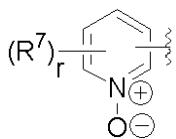
R³は、

【化 5】

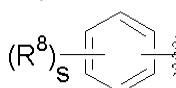


〔式中、R⁷はC₁～₄アルキルまたはCNであり；そして、
rは0、1または2である〕；

【化 6】

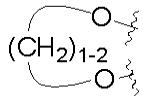
〔但し、R¹はピリジルまたはN-オキシド-含有基以外である〕；

【化 7】



〔式中、R⁸は、C N、ハロゲン、C₁~₄アルキル、C₁~₄アルコキシ、NO₂、CF₃、C₁~₄アシリル、CO₂R⁹（式中、R⁹はHまたはC₁~₄アルキルである）、または

【化8】



を表し；そして、

sは0、1または2である】；

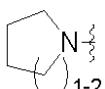
【化9】



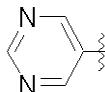
【化10】



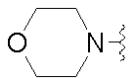
【化11】



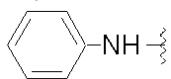
【化12】



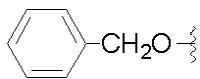
【化13】



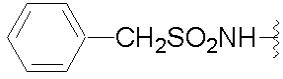
【化14】



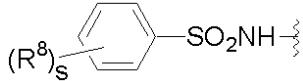
【化15】



【化16】



【化17】

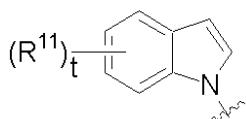


C₁~₄アルキル-SO₂NH-；

C N；

N(R¹~⁰)₂（式中、R¹~⁰はC₁~₄アルキルである）；または

【化 18】



〔式中、 $R^{1\sim 1}$ はハロゲンであり；そして、

t は 0、1 または 2 である〕；

を表し；

$R^{1\sim 2}$ は、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、 $C_{1\sim 4}$ アルコキシ、ハロゲンまたは CN (但し、 R^3 はシアノ以外である) を表し；そして、 u は 0、1 または 2 であり；

$R^{1\sim 3}$ は H または $R^{1\sim 2}$ を表し；そして、

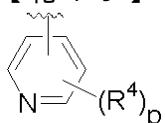
R^1 および R^3 の一方は、2 および 6 位で非置換の、3 - ピリジルまたは 3 - ピリジル - N - オキシド基である；

の化合物、またはそれらの医薬的に許容し得る塩。

【請求項 2】

式中、 R^1 が、

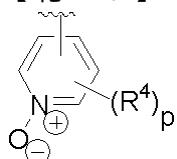
【化 19】



〔式中、 R^4 は $C_{1\sim 4}$ アルキルを表し；そして、

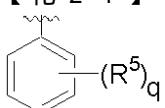
p は 0、1 または 2 である〕；

【化 20】



〔但し、 R^3 はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；または

【化 21】



〔式中、 R^5 は、 CN 、ハロゲン、 CHO または $C(O)N(R^6)_2$ (式中、 R^6 は H または $C_{1\sim 4}$ アルキルを表す) を表し；そして、

q は 0、1 または 2 である〕；

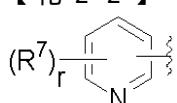
を表し；

R^2 が $C_{1\sim 4}$ アルキルを表し；そして、

m が 0、1 または 2 であり、

R^3 が、

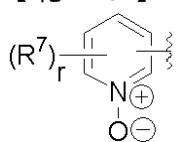
【化 22】



〔式中、 R^7 は $C_{1\sim 4}$ アルキルまたは CN であり；そして、

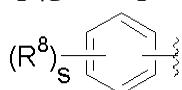
r は 0、1 または 2 である〕；

【化23】



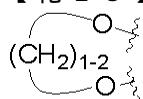
〔但し、R¹はピリジルまたはN-オキシド-含有基以外である〕；

【化24】



〔式中、R⁸は、CN、ハロゲン、C₁-₄アルキル、C₁-₄アルコキシ、NO₂、CF₃、C₁-₄アシル、CO₂R⁹（式中R⁹はHまたはC₁-₄アルキルである）、または

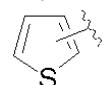
【化25】



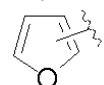
を表し；そして、

sは0、1または2である〕；

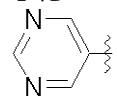
【化26】



【化27】

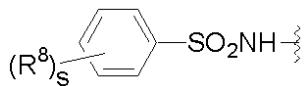


【化28】



または

【化29】

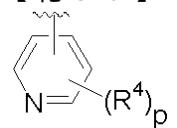


を表す、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

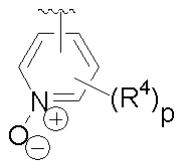
式中、R¹が、

【化30】



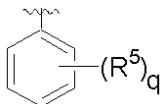
〔式中、R⁴はC₁-₄アルキルを表し；そして、pは0、1または2である〕；

【化31】



〔但し、R³はピリジルまたはN-オキシド-含有基以外である〕；または

【化32】



〔式中、R⁵は、CN、ハロゲン、CHOまたはC(O)N(R⁶)₂（式中、R⁶はHまたはC₁-₄アルキルを表す）を表し；そして、

qは0、1または2である〕、

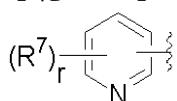
を表し、

R²がC₁-₄アルキルを表し；そして、

mが0、1または2であり；そして、

R³が、

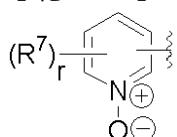
【化33】



〔式中、R⁷はC₁-₄アルキルまたはCNであり；そして、

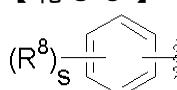
rは0、1または2である〕；

【化34】



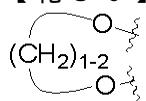
〔但し、R¹はピリジルまたはN-オキシド-含有基以外である〕；

【化35】



〔式中、R⁸は、CN、ハロゲン、C₁-₄アルキル、C₁-₄アルコキシ、NO₂、CF₃、C₁-₄アシル、CO₂R⁹（式中、R⁹はHまたはC₁-₄アルキルである）、または

【化36】



を表し；そして、

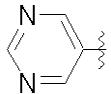
sは0、1または2である〕；

【化37】



または

【化38】

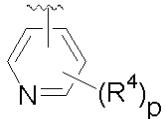


を表す、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

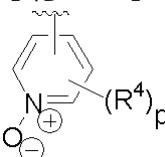
式中、R¹が、

【化39】



〔式中、R⁴はC₁～₄アルキルを表し；そして、pは0、1または2である〕；または

【化40】



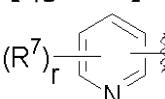
〔但し、R³はピリジルまたはN-オキシド-含有基以外である〕；
を表し、

R²がC₁～₄アルキルを表し；そして、

mが0、1または2であり；そして、

R³が、

【化41】



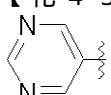
〔式中、R⁷はC₁～₄アルキルまたはCNであり；そして、rは0、1または2である〕；

【化42】



または

【化43】



を表す、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

請求項1に記載の化合物および医薬的に許容し得る担体を含む、医薬組成物。

【請求項6】

リアーゼ酵素を請求項1に記載の化合物と接触させることを含む、リアーゼ酵素の阻害方法。

【請求項7】

17-ヒドロキシラーゼ-C17,20リアーゼを請求項1に記載の化合物と接触させることを含む、17-ヒドロキシラーゼ-C17,20リアーゼの阻害方法。

【請求項8】

請求項 1 に記載の化合物の治療的有効量を対象に投与することを含む、17 - ヒドロキシラーゼ - C 17,20 リアーゼに関連する癌を有する対象の処置方法。

【請求項 9】

対象中の前立腺癌が処置されるように請求項 1 に記載の化合物の治療的有効量を対象に投与することを含む、対象中の前立腺癌の処置方法。

【請求項 10】

対象中の乳癌が処置されるように請求項 1 に記載の化合物の治療的有効量を対象に投与することを含む、対象中の乳癌の処置方法。

【請求項 11】

該対象が、靈長類、ウマ科、イヌ科またはネコ科である、請求項 8 ないし請求項 10 のいずれかに記載の方法。

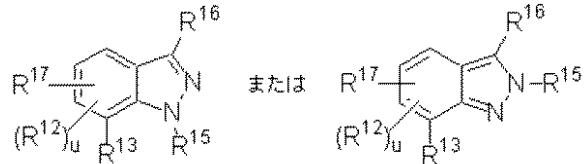
【請求項 12】

該対象がヒトである、請求項 8 ないし請求項 10 のいずれかに記載の方法。

【請求項 13】

式

【化 4 4】

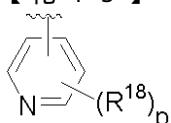


式中、R^{1~2} は、C_{1~4} アルキル、C_{1~4} アルコキシ、ハロゲンまたはCNを表し；そして、uは0、1または2であり；

R^{1~3} はHまたはR^{1~2} を表し；

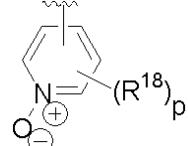
R^{1~5} は、

【化 4 5】



〔式中、R^{1~8} はC_{1~4} アルキルを表し；そしてpは0、1または2である〕；または

【化 4 6】

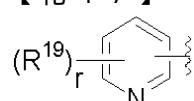


〔但し、R^{1~7} はピリジルまたはN-オキシド - 含有基以外である〕；を表し、

R^{1~6} はHまたはC_{1~4} アルキルを表し；そして、

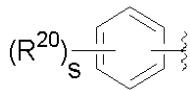
R^{1~7} は、

【化 4 7】



〔式中、R^{1~9} はC_{1~4} アルキルであり；そして、rは0、1または2である〕；または

【化48】



〔式中、 R^{20} は、ハロゲン、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、 $C_{1\sim 4}$ アルコキシ、 NO_2 、 CF_3 または CO_2R^{21} (式中、 R^{21} は H または $C_{1\sim 4}$ アルキルである) を表し；そして、
 s は 0、1 または 2 である〕；

を表し；そして、

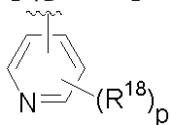
$R^{1\sim 5}$ および $R^{1\sim 7}$ の一方は、2 および 6 位で非置換の、3 - ピリジルまたは 3 - ピリジル - N - オキシド基である、

の化合物、またはそれらの医薬的に許容し得る塩。

【請求項14】

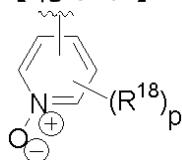
式中、 $R^{1\sim 5}$ が、

【化49】



〔式中、 $R^{1\sim 8}$ は $C_{1\sim 4}$ アルキルを表し；そして、
 p は 0、1 または 2 である〕；または

【化50】

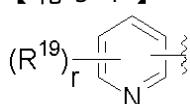


〔但し、 $R^{1\sim 7}$ はピリジルまたは N - オキシド - 含有基以外である〕；
 を表し、

$R^{1\sim 6}$ が H を表し；そして

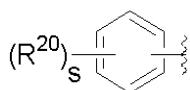
$R^{1\sim 7}$ が、

【化51】



〔式中、 $R^{1\sim 9}$ は $C_{1\sim 4}$ アルキルであり；そして、
 r は 0、1 または 2 である〕；または

【化52】



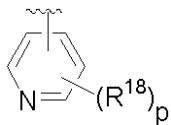
〔式中、 R^{20} は、ハロゲン、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、 $C_{1\sim 4}$ アルコキシ、 NO_2 、 CF_3 または CO_2R^{21} (式中、 R^{21} は H または $C_{1\sim 4}$ アルキルである) を表し；そして、
 s は 0、1 または 2 である〕；

を表す、請求項13に記載の化合物。

【請求項15】

式中、 $R^{1\sim 5}$ が、

【化53】



[式中、 $R^{1\sim 8}$ は $C_{1\sim 4}$ アルキルを表し；そして、

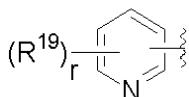
p は 0、1 または 2 である]；

を表し、

$R^{1\sim 6}$ が H を表し；そして、

$R^{1\sim 7}$ が、

【化54】



[式中、 $R^{1\sim 9}$ は $C_{1\sim 4}$ アルキルであり；そして、

r は 0、1 または 2 である]；

を表す、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項16】

請求項 13 に記載の化合物および医薬的に許容し得る担体を含む、医薬組成物。

【請求項17】

リアーゼ酵素を請求項 13 に記載の化合物と接触させることを含む、リアーゼ酵素の阻害方法。

【請求項18】

17 - ヒドロキシラーゼ - C17, 20 リアーゼを請求項 13 に記載の化合物と接触させることを含む、17 - ヒドロキシラーゼ - C17, 20 リアーゼの阻害方法。

【請求項19】

請求項 13 に記載の化合物の治療的有効量を対象に投与することを含む、17 - ヒドロキシラーゼ - C17, 20 リアーゼに関連する癌を有する対象の処置方法。

【請求項20】

対象中の前立腺癌が処置されるように請求項 13 に記載の化合物の治療的有効量を対象に投与することを含む、対象中の前立腺癌の処置方法。

【請求項21】

対象中の乳癌が処置されるように請求項 13 に記載の化合物の治療的有効量を対象に投与することを含む、対象中の乳癌の処置方法。

【請求項22】

該対象が、靈長類、ウマ科、イヌ科またはネコ科である、請求項 19 ないし請求項 21 のいずれかに記載の方法。

【請求項23】

該対象がヒトである、請求項 19 ないし請求項 21 のいずれかに記載の方法。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0008

【補正方法】変更

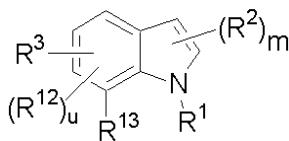
【補正の内容】

【0008】

発明の概要

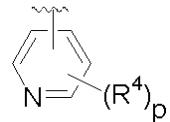
本発明は、例えば 17 - ヒドロキシラーゼ - C17, 20 - リアーゼなどの酵素のリアーゼ活性を阻害する置換 3 - ピリジルインドールおよびインダゾール化合物を提供する。本発明のインドール化合物は、式

【化1】



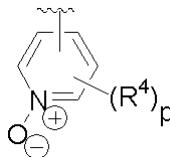
式中、R¹は、

【化2】



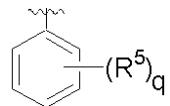
〔式中、R⁴はC₁～₄アルキルを表し；そして、pは0、1または2である〕；

【化3】



〔但し、R³はピリジルまたはN-オキシド-含有基以外である〕；または

【化4】



〔式中、R⁵は、CN、ハロゲン、CHOまたはC(O)N(R⁶)₂（式中、R⁶はHまたはC₁～₄アルキルを表す）を表し；そして、qは0、1または2である〕、
を表し、

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0009

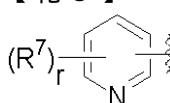
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0009】

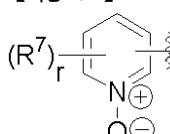
R²はC₁～₄アルキルを表し；そして、mは0、1または2であり、
R³は、

【化5】



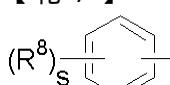
〔式中、R⁷はC₁～₄アルキルまたはCNであり；そして、rは0、1または2である〕；

【化6】



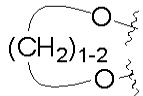
〔但し、R¹はピリジルまたはN-オキシド-含有基以外である〕；

【化7】



〔式中、R⁸は、CN、ハロゲン、C_{1～4}アルキル、C_{1～4}アルコキシ、NO₂、CF₃、C_{1～4}アシリル、CO₂R⁹（式中、R⁹はHまたはC_{1～4}アルキルである）、または

【化8】



を表し；そして、

sは0、1または2である〕；

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

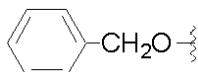
【補正対象項目名】0011

【補正方法】変更

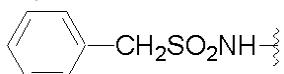
【補正の内容】

【0011】

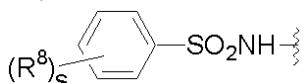
【化15】



【化16】



【化17】

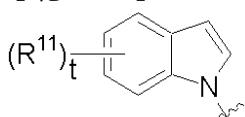


C_{1～4}アルキル-SO₂NH-；

CN；

N(R^{1～0})₂（式中、R^{1～0}はC_{1～4}アルキルである）；または

【化18】



〔式中、R^{1～1}はハロゲンであり；そして、tは0、1または2である〕；

を表し、

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0012

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0012】

R^{1～2}は、C_{1～4}アルキル、C_{1～4}アルコキシ、ハロゲンまたはCN（但し、R³はシアノ以外である）を表し；そして、uは0、1または2であり、

R^{1～3}はHまたはR^{1～2}を表す、

を有する。

【手続補正6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0014

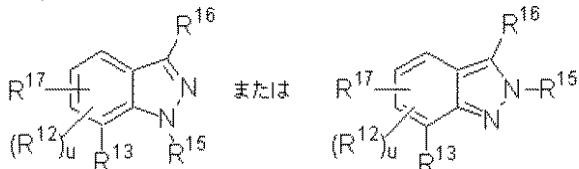
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0014】

本発明のインダゾール化合物は、式

【化19】

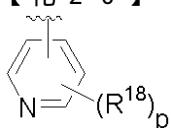


式中、 $R^{1\sim 2}$ は、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、 $C_{1\sim 4}$ アルコキシ、ハロゲンまたはCNを表し；そして、uは0、1または2であり、

$R^{1\sim 3}$ はHまたは $R^{1\sim 2}$ を表し、

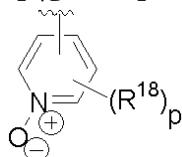
$R^{1\sim 5}$ は、

【化20】



式中、 $R^{1\sim 8}$ は $C_{1\sim 4}$ アルキルを表し；そしてpは0、1または2である】；または

【化21】



但し、 $R^{1\sim 7}$ はピリジルまたはN-オキシド-含有基以外である】、を表し、

【手続補正7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0015

【補正方法】変更

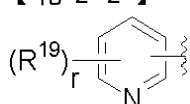
【補正の内容】

【0015】

$R^{1\sim 6}$ はHまたは $C_{1\sim 4}$ アルキルを表し、

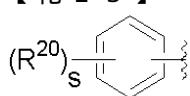
$R^{1\sim 7}$ は、

【化22】



式中、 $R^{1\sim 9}$ は $C_{1\sim 4}$ アルキルであり；そして、rは0、1または2である】；または

【化23】



式中、 $R^{2\sim 0}$ は、ハロゲン、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、 $C_{1\sim 4}$ アルコキシ、 NO_2 、 CF_3 または $CO_2R^{2\sim 1}$ (式中、 $R^{2\sim 1}$ はHまたは $C_{1\sim 4}$ アルキルである)を表し；そして

、sは0、1または2である】、

を表す、

を有する。

【手続補正8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0021

【補正方法】変更

【補正の内容】

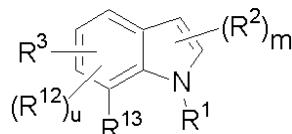
【0021】

発明の詳細な説明

本発明は、少なくとも部分的に、置換3-ピリジルインドールおよびインダゾール化合物が酵素17-ヒドロキシラーゼ-C17, 20-リアーゼを阻害するという発見に基づく。

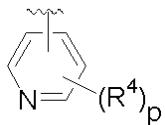
好ましい実施態様では、本発明のインドール化合物は、式

【化24】



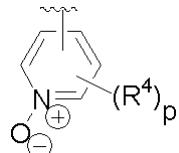
式中、R¹は、

【化25】



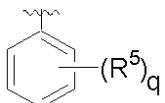
〔式中、R⁴はC₁~₄アルキルを表し；そして、pは0、1または2である〕；

【化26】



〔但し、R³はピリジルまたはN-オキシド-含有基以外である〕；または

【化27】



〔式中、R⁵は、CN、ハロゲン、CHOまたはC(O)N(R⁶)₂（式中、R⁶はHまたはC₁~₄アルキルを表す）を表し；そして、qは0、1または2である〕、を表し、

【手続補正9】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0022

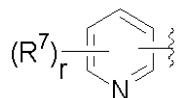
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0022】

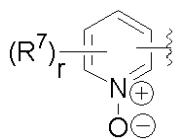
R²はC₁~₄アルキルを表し；そして、mは0、1または2であり、R³は、

【化28】



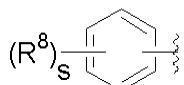
〔式中、 R^7 は $C_{1\sim4}$ アルキルまたは CN であり；そして、 r は 0、1 または 2 である〕；

【化 2 9】



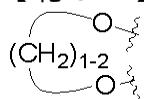
〔但し、 R^1 はピリジルまたは N -オキシド-含有基以外である〕；

【化 3 0】



〔式中、 R^8 は、 CN 、ハロゲン、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $C_{1\sim4}$ アルコキシ、 NO_2 、 CF_3 、 $C_{1\sim4}$ アシリル、 CO_2R^9 （式中 R^9 は H または $C_{1\sim4}$ アルキルである）、または

【化 3 1】



を表し；そして、

s は 0、1 または 2 である〕；

【手続補正 1 0】

【補正対象書類名】明細書

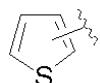
【補正対象項目名】0023

【補正方法】変更

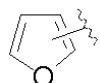
【補正の内容】

【0023】

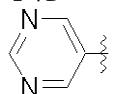
【化 3 2】



【化 3 3】

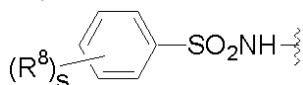


【化 3 4】



または

【化 3 5】



を表し、

$R^{1\sim2}$ は、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $C_{1\sim4}$ アルコキシ、ハロゲンまたは CN （但し、 R^3 はシアノ以外である）を表し；そして、 u は 0、1 または 2 であり、

$R^{1\sim3}$ は H または $R^{1\sim2}$ を表す、

を有する。

【手続補正 1 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0025

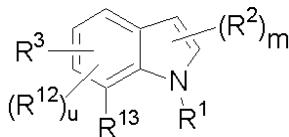
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0025】

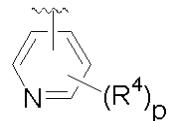
より好ましい実施態様では、本発明のインドール化合物は、式

【化36】



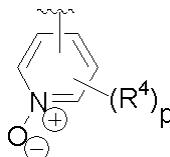
式中、R¹は、

【化37】



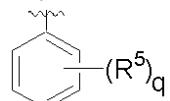
〔式中、R⁴はC₁～₄アルキルを表し；そして、pは0、1または2である〕；

【化38】



〔但し、R³はピリジルまたはN-オキシド-含有基以外である〕；または

【化39】



〔式中、R⁵は、CN、ハロゲン、CHOまたはC(O)N(R⁶)₂（式中、R⁶はHまたはC₁～₄アルキルを表す）を表し；そして、qは0、1または2である〕、
を表し、

【手続補正12】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0026

【補正方法】変更

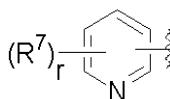
【補正の内容】

【0026】

R²はC₁～₄アルキルを表し；そして、mは0、1または2であり、

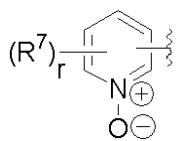
R³は、

【化40】



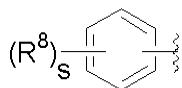
〔式中、R⁷はC₁～₄アルキルまたはCNであり；そして、rは0、1または2である〕；

【化41】



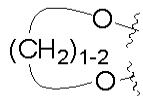
〔但し、R¹はピリジルまたはN-オキシド-含有基以外である〕；

【化42】



〔式中、R⁸は、CN、ハロゲン、C₁-₄アルキル、C₁-₄アルコキシ、NO₂、CF₃、C₁-₄アシル、CO₂R⁹（式中、R⁹はHまたはC₁-₄アルキルである）、または

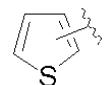
【化43】



を表し；そして

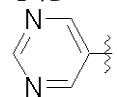
sは0、1または2である〕；

【化44】



または

【化45】



を表し、

R¹⁻²は、C₁-₄アルキル、C₁-₄アルコキシ、ハロゲンまたはCN（但し、R³はシアノ以外である）を表し；そして、uは0、1または2であり、

R¹⁻³はHまたはR¹⁻²を表す、

を有する。

【手続補正13】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0028

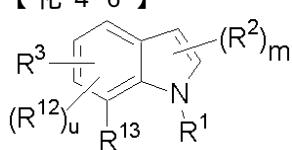
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0028】

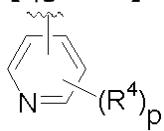
最も好ましい実施態様では、本発明のインドール化合物は、式

【化46】



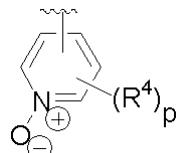
式中、R¹は、

【化47】



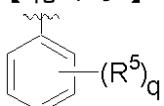
〔式中、R⁴はC₁~₄アルキルを表し；そして、pは0、1または2である〕；

【化48】



〔但し、R³はピリジルまたはN-オキシド-含有基以外である〕；または

【化49】



〔式中、R⁵は、CN、ハロゲン、CHOまたはC(O)N(R⁶)₂（式中、R⁶はHまたはC₁~₄アルキルを表す）を表し；そして、qは0、1または2である〕、
を表し、

【手続補正14】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0029

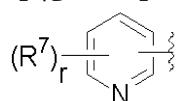
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0029】

R²はC₁~₄アルキルを表し；そして、mは0、1または2であり、
R³は、

【化50】



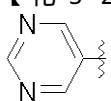
〔式中、R⁷はC₁~₄アルキルまたはCNであり；そして、rは0、1または2である〕；

【化51】



または

【化52】



を表し、

R^{1~2}は、C₁~₄アルキル、C₁~₄アルコキシ、ハロゲンまたはCN（但し、R³はシアノ以外である）を表し；そして、uは0、1または2であり、

R^{1~3}はHまたはR^{1~2}を表す、

を有する。

【手続補正15】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0 0 3 1

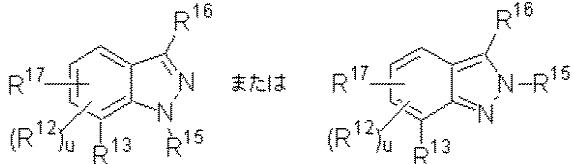
【補正方法】 変更

【補正の内容】

【0 0 3 1】

好みしい実施態様では、本発明のインダゾール化合物は、式

【化 5 3】

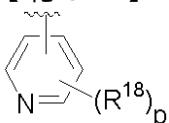


式中、 $R^{1\sim 2}$ は、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、 $C_{1\sim 4}$ アルコキシ、ハロゲンまたはCNを表し；そして、uは0、1または2であり、

$R^{1\sim 3}$ はHまたは $R^{1\sim 2}$ を表し、

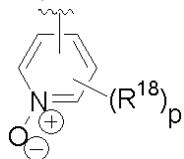
$R^{1\sim 5}$ は、

【化 5 4】



式中、 $R^{1\sim 8}$ は $C_{1\sim 4}$ アルキルを表し；そして、pは0、1または2である】；または

【化 5 5】

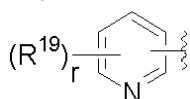


但し、 $R^{1\sim 7}$ はピリジルまたはN-オキシド-含有基以外である】、
を表し、

$R^{1\sim 6}$ はHを表し、

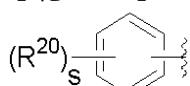
$R^{1\sim 7}$ は、

【化 5 6】



式中、 $R^{1\sim 9}$ は $C_{1\sim 4}$ アルキルであり；そして、rは0、1または2である】；または

【化 5 7】



式中、 $R^{2\sim 0}$ は、ハロゲン、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、 $C_{1\sim 4}$ アルコキシ、 NO_2 、 CF_3 または $CO_2R^{2\sim 1}$ (式中、 $R^{2\sim 1}$ はHまたは $C_{1\sim 4}$ アルキルである)を表し；そして、sは0、1または2である】、

を表す、

を有する。

【手続補正 1 6】

【補正対象書類名】 明細書

【補正対象項目名】 0 0 3 3

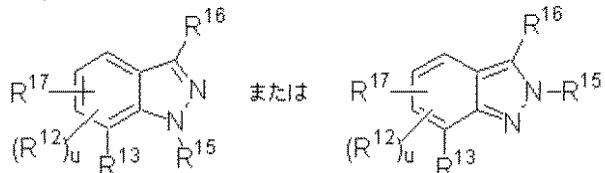
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 3 3】

より好ましい実施態様では、本発明のインダゾール化合物は、式

【化 5 8】



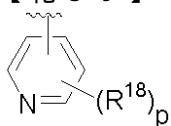
式中、

R^{1-2} は、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、ハロゲンまたは CN を表し；そして
、 u は 0、1 または 2 であり、

R^{1-3} は H または R^{1-2} を表し、

R^{1-5} は、

【化 5 9】

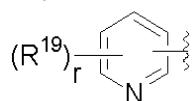


〔式中、 R^{1-8} は C_{1-4} アルキルを表し；そして、 p は 0、1 または 2 である〕、
を表し、

R^{1-6} は H を表し、

R^{1-7} は、

【化 6 0】



〔式中、 R^{1-9} は C_{1-4} アルキルであり；そして r は 0、1 または 2 である〕、
を表す、
を有する。