

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成19年5月17日(2007.5.17)

【公表番号】特表2006-528942(P2006-528942A)

【公表日】平成18年12月28日(2006.12.28)

【年通号数】公開・登録公報2006-051

【出願番号】特願2006-529742(P2006-529742)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 K 31/422 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 401/06

C 0 7 D 413/14 C S P

A 6 1 K 31/454

C 0 7 D 401/14

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/553

A 6 1 K 31/422

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成19年3月20日(2007.3.20)

【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

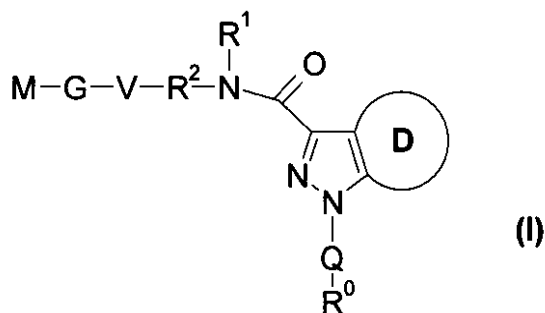
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

全ての立体異性体の形態における式 I

【化 1】



の化合物、あらゆる比率におけるそれらの混合物、およびその生理学上許容しうる塩。

式中、

R^0 は、

1) フェニル、ここにおいてフェニルは非置換または R^8 によって互いに独立して単、二または三置換されており、

2) ベンゾイミダゾリル、1,3-ベンゾジオキソリル、ベンゾフラニル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾチオフェニル、シンノリニル、クロマニル、インダゾリル、インドリル、イソクロマニル、イソインドリル、イソキノリニル、フェニルピリジル、フタラジニル、プテリジニル、プリニル、ピリジル、ピリドイミダゾリル、ピリドピリジニル、ピリドピリミジニル、ピリミジニル、キナゾリニル、キノリル、キノキサリニルまたは1,4,5,6-テトラヒドロ-ピリダジニルの群からのヘテロシクリル、ここにおいて該ヘテロシクリルは非置換または R^8 によって互いに独立して単、二または三置換されており、または

3) ピリジル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル、フリル、2-フリル、3-フリル；チエニル、2-チエニル、3-チエニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピリダジニルおよびピラジニルの群からのヘテロシクリル、ここにおいて該ヘテロシクリルは非置換または R^8 によって互いに独立して単、二または三置換されており、

そしてさらにピリジル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル、フリル、2-フリル、3-フリル；チエニル、2-チエニル、3-チエニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピリダジニルおよびピラジニルの群から選ばれる残基によって置換されており、ここにおいて該残基は非置換または R^8 によって互いに独立して単、二または三置換されており、

R^8 は、

1. F、Cl、BrまたはI、

2. $-C(O)-NH_2$ 、

3. $-(C_1-C_4)$ -アルキル、ここにおいてアルキルは非置換またはハロゲン、 $-OH$ またはメトキシ残基によって互いに独立して単、二または三置換されており、

4. $-O-(C_1-C_4)$ -アルキル、ここにおいてアルキルは非置換またはハロゲンまたはメトキシ残基によって互いに独立して単、二または三置換されており、

但し、 R^0 がアリールまたはヘテロシクリルであり、これらは上記定義されたとおりである場合、 R^8 は少なくとも1つのハロゲン、 $-C(O)-NH_2$ または $-O-(C_1-C_8)$ -アルキル残基であり、

部分構造Dは、フェニルであり、そして非置換または R^3 によって1、2、3または4回置換されており、

Qは、直接結合、 $-C(O)-$ ； $-SO_2-$ または $-(C_1-C_6)$ -アルキレン、 $-(C_0-C_2)$ -アルキレン- $C(O)-NR^{10}$ または $-(C_0-C_3)$ -アルキレン- $C(O)-O-(C_0-C_2)$ -アルキレンであり、

R^1 は、水素原子、 $-(C_1 - C_2)$ -アルキル、 $-(C_1 - C_3)$ -アルキレン- $C(O)-N$
 $H - R^0$ 、 $-(C_1 - C_3)$ -パーフルオロアルキレン、 $-(C_1 - C_3)$ -アルキレン- $C(O)$
 $-O - R^{15}$ 、 $-(C_1 - C_3)$ -アルキレン- $S(O)_2 - (C_1 - C_3)$ -アルキルまたは $-(C_1$
 $- C_3)$ -アルキレン- $S(O)_2 - N(R^{4'}) - R^{5'}$ であり、

ここにおいて $R^{4'}$ および $R^{5'}$ は、互いに独立して同一または異なり、水素原子または $-(C_1 - C_4)$ -アルキルであり、

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

$R^1 - N - R^2 - V$ は、アゼチジン、アゼチジノン、ピペリジン、ピペラジン、ピリジン、
 ピリミジン、ピロリジン、ピロリジノン、1,2,3-トリアジン、1,2,4-トリアジン、
 1,3,5-トリアジン、1,2,3-トリアゾール、1,2,4-トリアゾール、テトラ
 ジン、テトラゾール、1,4-ジアゼパン、1,2-ジアゼピン、1,3-ジアゼピン、1,
 4-ジアゼピン、アゼピン、ケトピペラジン、1,4-オキサゼパン、オキサゾール、イ
 ソオキサゾール、イソオキサゾリジン、2-イソオキサゾリン、モルホリン、チアゾール、
 イソチアゾール、チアジアゾールまたはチオモルホリンの群からの4~7員環式基を形
 成することができ、ここにおいて該環式基は非置換または R^{14} によって互いに独立して単
 、二または三置換されており、

R^{14} は、フッ素、塩素、 $-OH$ 、 $=O$ 、 $-(C_1 - C_8)$ -アルキル、 $-C(O)-OH$ 、 $-$
 CN 、 $-NH_2$ 、 $-C(O)-O-(C_1 - C_4)$ -アルキル、 $-C(O)-NH-(C_1 - C_8)$ -
 アルキル、 $-C(O)-N-[(C_1 - C_8)-アルキル]_2$ 、 $-C(O)-NH_2$ または $-N(R^{18})$
 $-R^{21}$ であり、

ここにおいて R^{18} および R^{21} は互いに独立して水素原子、 $-(C_1 - C_3)$ -パーフルオロ
 アルキルまたは $-(C_1 - C_4)$ -アルキルであり、

V は、

1. アザインドール(1H-ピロロピリジン)、アジリジン、アジリン、アゼチジン、ア
 ゼチジノン、1,4-ジアゼパン、ピロール、ピロリジン、ピリドニル、イミダゾール、
 ピラゾール、1,2,3-トリアゾール、1,2,4-トリアゾール、テトラゾール、ピリジン、
 ピリミジン、ピラジン、1,2,3-トリアジン、1,2,4-トリアジン、1,3,5-
 トリアジン、テトラジン、テトラゾール、アゼピン、ジアジリン、1,2-ジアゼピン、
 1,3-ジアゼピン、1,4-ジアゼピン、ピリダジン、ピペリジン、ピペラジン、ピロリ
 ジノン、ケトピペラジン、フラン、ピラン、ジオキソール、1,4-オキサゼパン、オキ
 サゾール、イソオキサゾール、2-イソオキサゾリン、イソオキサゾリジン、モルホリン
 、オキシラン、オキサジリジン、1,3-ジオキソレン、1,3-ジオキソラン、1,2-
 オキサジン、1,3-オキサジン、1,4-オキサジン、オキサジリジン、チオフエン、チ
 オピラン、チエタン、チアゾール、イソチアゾール、イソチアゾリン、イソチアゾリジン
 、1,2-オキサチオラン、チオジアゾール、チオピラン、1,2-チアジン、1,3-チ
 アゾール、1,3-チアジン、1,4-チアジン、チアジアジンまたはチオモルホリンから
 誘導される化合物を含む群からの環式残基、

ここにおいて該環式残基は非置換または R^{14} によって互いに独立して単、二または三置
 換されており、または

2. フェニルであり、ここにおいてフェニルは非置換または R^{14} によって互いに独立し
 て単、二または三置換されており、

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

m は、整数0、1、2、3または4であり、

M は、

1. 水素原子、

2. ヘテロシクリル、ここにおいてヘテロシクリルはアゼパン、アゼピン、1,4-ジ
 アゼパン、1,2-ジアゼピン、1,3-ジアゼピン、1,4-ジアゼピン、イミダゾール
 、イソチアゾール、イソオキサゾール、イソオキサゾリジン、2-イソオキサゾリン、ケ
 トモルホリン、ケトピペラジン、モルホリン、オキサゾール、[1,4]-オキサゼパン、
 ピペラジン、ピペラジノン、ピペリジン、ピペリジノン、ピラジン、ピリダジン、ピリダ

ジノン、ピリジン、ピリドン、ピリミジン、ピロリジン、ピロリジノン、テトラヒドロピラン、1,4,5,6-テトラヒドロ-ピリダジニル、テトラジン、テトラゾール、チアジアゾール、チアゾール、チオモルホリン、チオフエン、1,2,3-トリアジン、1,2,4-トリアジン、1,3,5-トリアジン、1,2,3-トリアゾールまたは1,2,4-トリアゾールから誘導することができる基からの残基であり、ここにおいて該ヘテロシクリルは非置換または R^{14} によって互いに独立して単、二または三置換されており、

3. - $(C_1 - C_6)$ - アルキル、ここにおいてアルキルは非置換または R^{14} によって互いに独立して単、二または三置換されており、または

4. $(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、または

5. - $C(O) - N(R^{11}) - R^{12}$

であり、

R^3 は、

1) 水素原子、

2) ハロゲン、

3) - $(C_1 - C_4)$ - アルキル、ここにおいてアルキルは非置換または R^{13} によって互いに独立して単、二または三置換されており、

4) - $(C_1 - C_3)$ - パーフフルオロアルキル、

5) フェニル、ここにおいてフェニルは非置換または R^{13} によって互いに独立して単、二または三置換されており、

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

a) 水素原子、

b) - $(C_1 - C_4)$ - アルキル、ここにおいてアルキルは非置換または R^{13} によって互いに独立して単、二または三置換されており、

c) フェニル、ここにおいてフェニルは非置換または R^{13} によって互いに独立して単、二または三置換されており、

d) - CF_3 、または

e) CHF_2

であり、

7) - CN 、

8) - $NR^{10} - SO_2 - R^{10}$ 、

9) - $SO_s - R^{11}$ 、ここにおいて s は 1 または 2 であり、

10) - $SO_t - N(R^{11}) - R^{12}$ 、ここにおいて t は 1 または 2 であり、

11) - $(C_0 - C_4)$ - アルキレン - $C(O) - R^{11}$ 、

12) - $(C_0 - C_4)$ - アルキレン - $C(O) - O - R^{11}$ 、

13) - $(C_0 - C_4)$ - アルキレン - $C(O) - N(R^{11}) - R^{12}$ 、

14) - $(C_0 - C_4)$ - アルキレン - $N(R^{11}) - R^{12}$ 、

15) - $(C_0 - C_2)$ アルキレン - $C(O) - O - (C_2 - C_4)$ - アルキレン - $O - C(O) - (C_1 - C_4)$ - アルキル、

16) - $C(O) - O - C(R^{15}, R^{16}) - O - C(O) - R^{17}$ 、

17) - $(C_0 - C_2)$ アルキレン - $C(O) - O - (C_2 - C_4)$ - アルキレン - $O - C(O) - O - (C_1 - C_6)$ - アルキル、

18) - $C(O) - O - C(R^{15}, R^{16}) - O - C(O) - O - R^{17}$ 、

20) - $(C_0 - C_3)$ - アルキレン - $O - CH_2 - CF_2 - CH_2 - O - (C_0 - C_3)$ - アルキル、

21) - $(C_0 - C_3)$ - アルキレン - $O - CH_2 - CF_2 - CF_2 - CH_2 - O - (C_0 - C_3)$ - アルキル、

22) - $(C_0 - C_3)$ - アルキレン - $O - CH_2 - (C_1 - C_3)$ - パーフフルオロアルキレン - $CH_2 - OH$ 、

23) - $SO_w - N(R^{11}) - R^{13}$ 、ここにおいて w は 1 または 2 であり、

24) - $(C_0 - C_4)$ - アルキレン - $C(O) - N(R^{11}) - R^{13}$ 、

26) 以下：

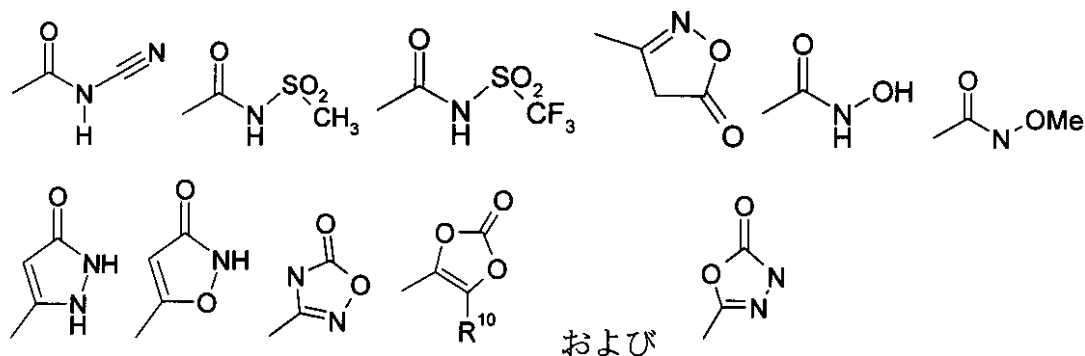
C1=CN2C(=O)N1C2=O
C1=NC(=O)N1C2=CC=C2
CC(=O)NC#N
CC(=O)NS(=O)(=O)C
CC(=O)NS(=O)(=O)C(F)(F)F
CC1=CN(C1=O)C2=CC=C2
CC(=O)NO
CC(=O)NOC
CC1=NC2=C(N1)NC(=O)N2C
CC1=CC=C2C(=O)N1C2=O
CC(=O)OC1=C(C)OC(=O)O1
CC1=CC=C2C(=O)N1C2=O

および

2つの -OR¹⁹ 残基が隣接した原子に結合している場合、それらはそれらが結合している原子と一緒に1,3-ジオキサソール環または2,3-ジヒドロ-[1,4]ジオキシン環を形成することができ、これはR¹³によって1、2、3または4回置換されており、

R^{13} は、フッ素、塩素、 $-NO_2$ 、 $-CN$ 、 $=O$ 、 $-OH$ 、 $-CF_3$ 、 $-C(O)-O-R^{10}$ 、 $-C(O)-N(R^{10})-R^{20}$ 、 $-N(R^{10})-R^{20}$ 、 $-(C_0-C_3)$ -アルキレン- $O-R^{10}$ 、 $-Si-(CH_3)_3$ 、 $-N(R^{10})-S(O)_2-R^{10}$ 、 $-S-R^{10}$ 、 $-SO_2-R^{10}$ 、 $-S(O)_2-N(R^{10})-R^{20}$ 、 $-C(O)-R^{10}$ 、 $-(C_1-C_8)$ -アルキル、 $-(C_1-C_8)$ -アルコキシ、フェニル、フェニルオキシ、 $-O-CF_3$ 、 $-(C_1-C_3)$ -パーフルオロアルキル、 $-NH-C(O)-NH-R^{10}$ 、 $-(C_0-C_4)$ -アルキル- $C(O)-O-C(R^{15}, R^{16})-O-C(O)-R^{17}$ 、 $-(C_1-C_4)$ -アルコキシ-フェニル、 $-(C_0-C_4)$ -アルキル- $C(O)-O-C(R^{15}, R^{16})-O-C(O)-O-R^{17}$ 、 $-O-R^{15}$ 、 $-NH-C(O)-O-R^{10}$ 、または以下：

【化 3】



からの残基であり、ここにおいて Me はメチルであり、

R^{10} および R^{20} は、互いに独立して水素、 $-(C_1 - C_6)$ -アルキル、 $-(C_0 - C_4)$ -アルキル-OH、 $-(C_0 - C_4)$ -アルキル-O- $-(C_1 - C_4)$ -アルキルまたは $-(C_1 - C_3)$ -パーフルオロアルキルであり、

R^{15} および R^{16} は、互いに独立して水素、 $-(C_1 - C_6)$ -アルキルであるか、または一緒になってシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルの群からの環を形成し、ここにおいてそれぞれの環は非置換または R^{10} によって 1 ~ 3 回置換されており、そして

R^{17} は、 $-(C_1 - C_6)$ -アルキル、 $-(C_1 - C_6)$ -アルキル-OH、 $-(C_1 - C_6)$ -アルキル-O- $-(C_1 - C_6)$ -アルキル、 $-(C_3 - C_8)$ -シクロアルキル、 $-(C_1 - C_6)$ -アルキル-O- $-(C_1 - C_8)$ -アルキル- $-(C_3 - C_8)$ -シクロアルキル、 $-(C_1 - C_6)$ -アルキル- $-(C_3 - C_8)$ -シクロアルキルであり、ここにおいて該シクロアルキル環は非置換または-OH、-O- $-(C_1 - C_4)$ -アルキルまたは R^{10} によって 1、2 または 3 回置換されている。

【請求項 2】

R^0 は、

1) フェニル、ここにおいてフェニルは非置換または R^8 によって互いに独立して単、二または三置換されており、

2) インドリル、イソインドリル、ベンゾフラニル、ベンゾチオフェニル、1,3-ベンゾジオキソリル、インダゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、キノリニル、イソキノリニル、クロマニル、イソクロマニル、シンノリニル、キナゾリニル、キノキサリニル、フタラジニル、ピリドイミダゾリル、ピリドピリジニル、ピリドピリミジニル、ピリジル、プリニルおよびプテリジニルの群から選ばれるヘテロシクリル、ここにおいて該ヘテロシクリルは非置換または R^8 によって互いに独立して単、二または三置換されており、

3) ピリジル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル、フリル、2-フリル、3-フリル；チエニル、2-チエニル、3-チエニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピリダジニルおよびピラジニルの群からのヘテロシクリル、ここにおいて該ヘテロシクリルは非置換または R^8 によって互いに独立して単、二または三置換されており、

そしてさらにピリジル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、ピロリル、2-ピロリル、3-ピロリル、フリル、2-フリル、3-フリル；チエニル、2-チエニル、3-チエニル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピリダジニルおよびピラジニルの群から選ばれる残基によって置換されており、ここにおいて該残基は非置換または R^8 によって互いに独立して単、二または三置換されており、

R^8 は、

1. F、Cl、BrまたはI、

2. $-C(O)-NH_2$ 、

3. $-(C_1-C_4)$ -アルキル、ここにおいてアルキルは非置換またはハロゲン、 $-OH$ またはメトキシ残基によって互いに独立して単、二または三置換されており、

4. $-O-(C_1-C_4)$ -アルキル、ここにおいてアルキルは非置換またはハロゲンまたはメトキシ残基によって互いに独立して単、二または三置換されており、

但し、 R^0 がアリールまたはヘテロシクリルであり、これらは上記定義されたとおりである場合、 R^8 は少なくとも1つのハロゲン、 $-C(O)-NH_2$ または $-O-(C_1-C_8)$ -アルキル残基であり、

部分構造Dは、フェニルであり、そして非置換または R^3 によって1、2、3または4回置換されており、

Qは、直接結合、 $-C(O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-C(O)-O-$ メチレン、 $-(C_1-C_6)$ -アルキレンまたは $-(C_0-C_2)$ -アルキレン- $-C(O)-NR^{10}$ -であり、

R^1 は、水素原子または $-(C_1-C_2)$ -アルキルであり、

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

R^1-N-R^2-V は、ピペリジン、ピペラジン、ピリジン、ピリミジン、ピロリジン、ピロリジノン、1,2,3-トリアジン、1,2,4-トリアジン、1,3,5-トリアジン、1,2,3-トリアゾール、1,2,4-トリアゾール、テトラジン、テトラゾール、1,2-ジアゼピン、1,3-ジアゼピン、1,4-ジアゼピン、アゼピン、ケトピペラジン、オキサゾール、イソオキサゾール、イソオキサゾリジン、2-イソオキサゾリン、モルホリン、チアゾール、イソチアゾール、チアジアゾールまたはチオモルホリンの群からの4~7員環式基を形成することができ、ここにおいて該環式基は非置換または R^{14} によって互いに独立して単、二または三置換されており、

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

Vは、

1. アザインドリル(1H-ピロロピリジル)、アゼチジン、アゼピン、アジリジン、アジリン、1,4-ジアゼパン、1,2-ジアゼピン、1,3-ジアゼピン、1,4-ジアゼピン、ジアジリン、1,3-ジオキサラン、ジオキサゾール、フラン、イミダゾール、イソキノリン、イソチアゾール、イソチアゾリジン、イソチアゾリン、イソオキサゾール、2-イソオキサゾリン、イソオキサゾリジン、ケトピペラジン、モルホリン、1,2-オキサジン、1,3-オキサジン、1,4-オキサジン、オキサゾール、1,2-オキサチオラン、ピペリジン、ピラン、ピラジン、ピラゾール、ピリダジン、ピペラジン、ピリジン、ピリドン、ピリミジン、ピロール、ピロリジン、ピロリジノン、キナゾリン、キノリン、テトラジン、テトラゾール、チアジアジン、1,2-チアジン、1,3-チアジン、1,4-チアジン、1,3-チアゾール、チエタン、チオモルホリン、チオフエン、チオピラン、1,2,3-トリアジン、1,2,4-トリアジン、1,3,5-トリアジン、1,2,3-トリアゾールまたは1,2,4-トリアゾールから誘導される化合物を含む群からの環式残基、ここにおいて該環式残基は非置換または R^{14} によって互いに独立して単、二または三置換されており、または

2. フェニルであり、ここにおいてフェニルは非置換または R^{14} によって互いに独立して単、二または三置換されており、または

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

mは、整数0、1、2、3または4であり、

Mは、

1. 水素原子、

2. ヘテロシクリル、ここにおいてヘテロシクリルは1,4-ジアゼパン、ケトモルホリン、チオフエン、ピリダゾン、ピペリジン、ピペラジン、ピリジン、ピリミジン、ピロリジン、ピロリジノン、ピリドニル、イミダゾール、ピリダジン、ピラジン、1,2,3-トリアジン、1,2,4-トリアジン、1,3,5-トリアジン、1,2,3-トリアゾール、1,2,4-トリアゾール、テトラジン、テトラゾール、1,2-ジアゼピン、1,3-ジア

ゼピン、1,4-ジアゼピン、アゼピン、ケトピペラジン、オキサゾール、イソオキサゾール、イソオキサゾリジン、2-イソオキサゾリン、モルホリン、チアゾール、イソチアゾール、テトラヒドロピラン、1,4,5,6-テトラヒドロ-ピリダジニル、チアジアゾールまたはチオモルホリンから誘導することができる基からの残基であり、ここにおいて該ヘテロシクリルは非置換または R^{14} によって互いに独立して単、二または三置換されており、

3. $-(C_1 - C_6)$ -アルキル、ここにおいてアルキルは非置換または R^{14} によって互いに独立して単、二または三置換されており、または

4. $(C_3 - C_6)$ -シクロアルキルであり、

R^3 は、

1) 水素原子、

2) ハロゲン、

3) $-(C_1 - C_4)$ -アルキル、ここにおいてアルキルは非置換または R^{13} によって互いに独立して単、二または三置換されており、

4) $-(C_1 - C_3)$ -パーフルオロアルキル、

5) フェニル、ここにおいてフェニルは非置換または R^{13} によって互いに独立して単、二または三置換されており、

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

a) 水素原子、

b) $-(C_1 - C_4)$ -アルキル、ここにおいてアルキルは非置換または R^{13} によって互いに独立して単、二または三置換されており、または

c) フェニル、ここにおいてフェニルは非置換または R^{13} によって互いに独立して単、二または三置換されており、

d) $-CF_3$ 、または

e) $-CHF_2$

であり、

7) $-CN$ 、

8) $-NR^{10}-SO_2-R^{10}$ 、

9) $-SO_s-R^{11}$ 、ここにおいて s は1または2であり、

10) $-SO_t-N(R^{11})-R^{12}$ 、ここにおいて t は1または2であり、

11) $-(C_0 - C_4)$ -アルキレン- $C(O)-R^{11}$ 、

12) $-(C_0 - C_4)$ -アルキレン- $C(O)-O-R^{11}$ 、

13) $-(C_0 - C_4)$ -アルキレン- $C(O)-N(R^{11})-R^{12}$ 、

14) $-(C_0 - C_4)$ -アルキレン- $N(R^{11})-R^{12}$ 、

15) $-(C_0 - C_2)$ アルキレン- $C(O)-O-(C_2 - C_4)$ -アルキレン-O- $C(O)-(C_1 - C_4)$ -アルキル、

16) $-C(O)-O-C(R^{15}, R^{16})-O-C(O)-R^{17}$ 、

17) $-(C_0 - C_2)$ アルキレン- $C(O)-O-(C_2 - C_4)$ -アルキレン-O- $C(O)-O-(C_1 - C_6)$ -アルキル、

18) $-C(O)-O-C(R^{15}, R^{16})-O-C(O)-O-R^{17}$ 、

19) $-(C_0 - C_3)$ -アルキレン-O- $CH_2-CF_2-CH_2-O-(C_0 - C_3)$ -アルキル、

20) $-(C_0 - C_3)$ -アルキレン-O- $CH_2-CF_2-CF_2-CH_2-O-(C_0 - C_3)$ -アルキル、

21) $-(C_0 - C_3)$ -アルキレン-O- $CH_2-(C_1 - C_3)$ -パーフルオロアルキレン- CH_2-OH 、

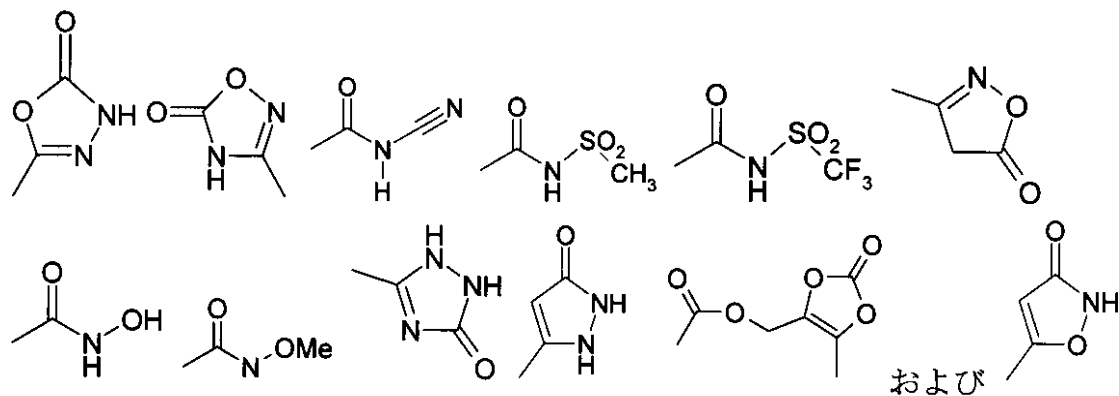
22) $-SO_w-N(R^{11})-R^{13}$ 、ここにおいて w は1または2であり、

23) $-(C_0 - C_4)$ -アルキレン- $C(O)-N(R^{11})-R^{13}$ 、

24) $-(C_0 - C_4)$ -アルキレン- $N(R^{11})-R^{13}$ または

25) 以下：

【化 4】



からの残基であり、ここにおいてMeはメチルであり、

R^{11} および R^{12} は、互いに独立して同一または異なり、そして

1) 水素原子、

2) $-(C_1 - C_4)$ - アルキル、ここにおいてアルキルは非置換または R^{13} によって互いに独立して単、二または三置換されており、

3) $-(C_0 - C_6)$ - アルキル - $-(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、

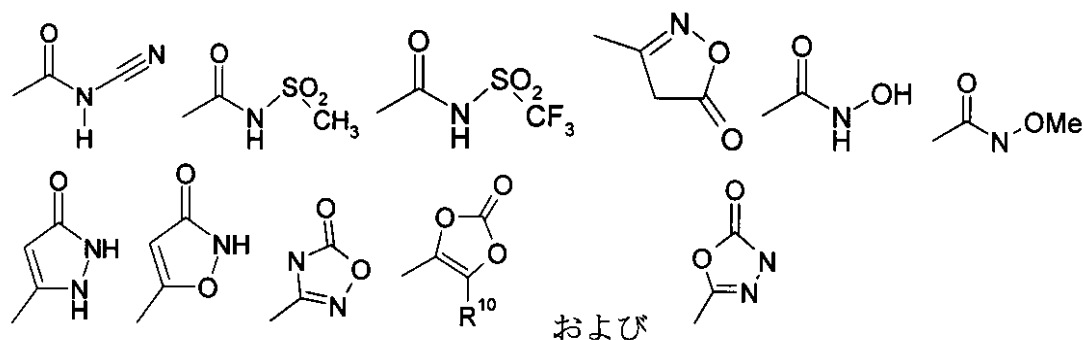
4) $-O - R^{17}$ 、または

5) $-(C_0 - C_6)$ - アルキル - $-(C_4 - C_{15})$ - ヘテロシクリル、ここにおいてアルキルおよびヘテロシクリルは互いに独立して非置換または R^{13} によって単、二または三置換されており、そしてここにおいてヘテロシクリルはアゼチジン、シクロプロピル、シクロブチル、4,5 - ジヒドロ - オキサゾール、イミダゾリジン、モルホリン、(1,4) - オキサゼパン、オキサゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、ピロリジン、テトラヒドロチオフェン、チアゾリジンまたはチオモルホリンの群から選ばれるか、または

R^{11} および R^{12} は、それらが結合している窒素原子と一緒になって複素環式環を形成し、これはアゼチジン、シクロプロピル、シクロブチル、4,5 - ジヒドロ - オキサゾール、イミダゾリジン、モルホリン、(1,4) - オキサゼパン、オキサゾリジン、ピペリジン、ピペラジン、ピロリジン、テトラヒドロチオフェン、チアゾリジンまたはチオモルホリンの群から選ばれ、

R^{13} は、フッ素、 $-CN$ 、 $=O$ 、 $-OH$ 、 $-CF_3$ 、 $-C(O) - O - R^{10}$ 、 $-C(O) - N(R^{10}) - R^{20}$ 、 $-N(R^{10}) - R^{20}$ 、 $-(C_3 - C_6)$ - シクロアルキル、 $-(C_0 - C_3)$ - アルキレン - $O - R^{10}$ 、 $-Si - (CH_3)_3$ 、 $-S - R^{10}$ 、 $-SO_2 - R^{10}$ 、 $-(C_1 - C_3)$ - パーフフルオロアルキル、または以下：

【化 5】



からの残基であり、ここにおいてMeはメチルであり、

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

R^{15} および R^{16} は、互いに独立して水素、 $-(C_1 - C_4)$ - アルキルであるか、または一

緒になってシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルまたはシクロヘキシルの群からの環を形成し、ここにおいてそれぞれの環は非置換または R^{10} によって 1 ~ 3 回置換されており、そして

R^{17} は、 $-(C_1 - C_6)$ -アルキル、 $-(C_1 - C_6)$ -アルキル-OH、 $-(C_1 - C_6)$ -アルキル-O- $-(C_1 - C_6)$ -アルキル、 $-(C_3 - C_8)$ -シクロアルキル、 $-(C_1 - C_6)$ -アルキル-O- $-(C_1 - C_8)$ -アルキル- $-(C_3 - C_8)$ -シクロアルキル、 $-(C_1 - C_6)$ -アルキル- $-(C_3 - C_8)$ -シクロアルキルであり、ここにおいて該シクロアルキル環は非置換または-OH、-O- $-(C_1 - C_4)$ -アルキルまたは R^{10} によって 1、2 または 3 回置換されている、

請求項 1 に記載の式 I の化合物、その全ての立体異性体の形態、あらゆる比率におけるこれらの混合物、およびその生理学上許容しうる塩。

【請求項 3】

R^0 は、

1) フェニル、ここにおいてフェニルは非置換または R^8 によって互いに独立して単置換または二置換されており、

2) ピリジル、ここにおいてピリジルは非置換または R^8 によって互いに独立して単置換または二置換されており、または

3) チエニル、チアジアゾリル、イソオキサゾリルおよびチアゾリルの群からのヘテロシクリル、ここにおいて該ヘテロシクリルは、チエニル、2 - チエニルおよび 3 - チエニルの群から選ばれる残基によって置換されており、ここにおいて該残基は非置換または R^8 によって互いに独立して単置換または二置換されており、

R^8 は、F、Cl、Br、 $-OCH_3$ 、 $-C(O)-NH_2$ または $-O-CF_3$ であり、

部分構造 D は、フェニルであり、そして非置換または R^3 によって 1、2、3 または 4 回置換されており、

Q は、直接結合、 $-C(O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-C(O)-O-$ メチレン、 $-CH_2-C(O)-NH-$ 、メチレンまたはエチレンであり、

R^1 は、水素原子であり、

R^2 は、直接結合またはメチレンであり、

R^1-N-R^2-V は、アゼチジン、ピロリジン、ピペリジンおよびピペラジンの群からの 4 ~ 8 員環式基を形成することができ、

R^{14} は、フッ素、塩素、メチル、エチル、 $=O$ 、 $-SO_2-CH_3$ または $-NH_2$ であり、

V は、

1. アザインドリル(1H-ピロロピリジル)、アゼチジン、1,4-ジアゼパン、イソオキサゾール、イソキノリン、ピペラジン、ピペリジン、ピラジン、ピリダジン、ピリミジン、ピロリジン、キナゾリン、キノリンまたはテトラヒドロピランから誘導される化合物を含む群からの残基、

ここにおいて該環式残基は非置換または R^{14} によって互いに独立して単置換または二置換されており、または

2. フェニルであり、ここにおいてフェニルは非置換または R^{14} によって互いに独立して単置換または二置換されており、

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

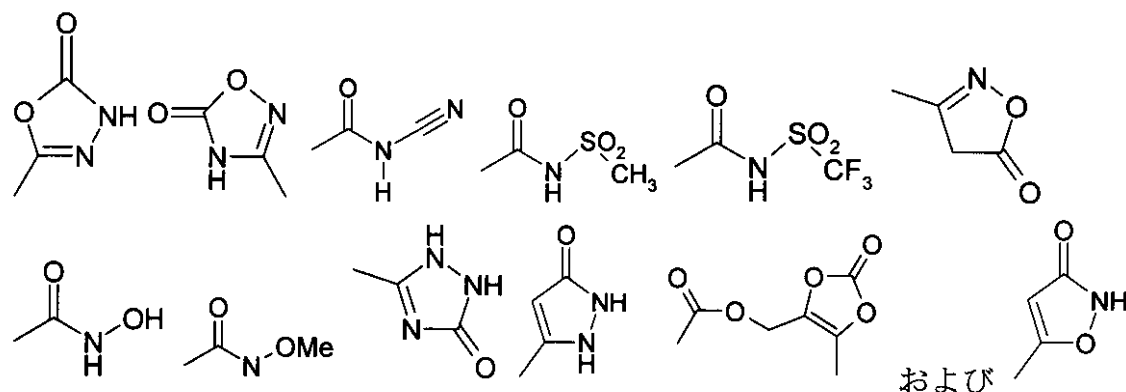
m は、整数 0、1 または 2 であり、

M は、水素原子、 $(C_2 - C_4)$ -アルキル、アゼパニル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、イミダゾリル、ケトモルホリニル、モルホリニル、[1,4]オキサゼパニル、ピペリジニル、フェニル、ピペリドニル、ピラジニル、ピラゾリル、ピリダジニル、ピリジル、ピリミジル、ピロリジニル、1,4,5,6-テトラヒドロ-ピリダジニルまたはテトラヒドロピラニルであり、ここにおいて該残基は非置換または R^{14} によって互いに独立して単置換または二置換されており、

R^3 は、

- 1) 水素原子、
 - 2) フッ素、塩素、
 - 3) $-(C_1 - C_4)$ -アルキル、ここにおいてアルキルは非置換または R^{13} によって互いに独立して単、二または三置換されており、
 - 4) $-(C_1 - C_3)$ -パーフルオロアルキル、
 - 5) フェニル、ここにおいてフェニルは非置換または R^{13} によって互いに独立して単、二または三置換されており、
 - 6) $-(C_0 - C_2)$ -アルキレン - O - R^{19} 、ここにおいて R^{19} は
 - a) 水素原子、
 - b) $-(C_1 - C_4)$ -アルキル、ここにおいてアルキルは非置換または R^{13} によって互いに独立して単、二または三置換されており、または
 - c) フェニル、ここにおいてフェニルは非置換または R^{13} によって互いに独立して単、二または三置換されており、
 - d) $-CF_3$ 、または
 - e) $-CHF_2$
- であり、
- 7) $-CN$ 、
 - 8) $-NR^{10} - SO_2 - R^{10}$ 、
 - 9) $-SO_s - R^{11}$ 、ここにおいて s は 1 または 2 であり、
 - 10) $-SO_t - N(R^{11}) - R^{12}$ 、ここにおいて t は 1 または 2 であり、
 - 11) $-(C_0 - C_4)$ -アルキレン - $C(O) - R^{11}$ 、
 - 12) $-(C_0 - C_4)$ -アルキレン - $C(O) - O - R^{11}$ 、
 - 13) $-(C_0 - C_4)$ -アルキレン - $C(O) - N(R^{11}) - R^{12}$ 、
 - 14) $-(C_0 - C_4)$ -アルキレン - $N(R^{11}) - R^{12}$ 、
 - 15) $-(C_0 - C_2)$ アルキレン - $C(O) - O - (C_2 - C_4)$ -アルキレン - $O - C(O) - (C_1 - C_4)$ -アルキル、
 - 16) $-C(O) - O - C(R^{15}, R^{16}) - O - C(O) - R^{17}$ 、
 - 17) $-(C_0 - C_2)$ アルキレン - $C(O) - O - (C_2 - C_4)$ -アルキレン - $O - C(O) - O - (C_1 - C_6)$ -アルキル、
 - 18) $-C(O) - O - C(R^{15}, R^{16}) - O - C(O) - O - R^{17}$ 、
 - 19) $-(C_0 - C_4)$ -アルキレン - $C(O) - N(R^{11}) - R^{13}$ 、または
 - 20) 以下：

【化 6】



からの残基であり、ここにおいて Me はメチルであり、

R^{11} および R^{12} は、互いに独立して同一または異なり、そして

- 1) 水素原子、
- 2) $-(C_1 - C_4)$ -アルキル、ここにおいてアルキルは非置換または R^{13} によって互いに独立して単、二または三置換されており、
- 3) $-(C_0 - C_6)$ -アルキル - $(C_3 - C_6)$ -シクロアルキル、

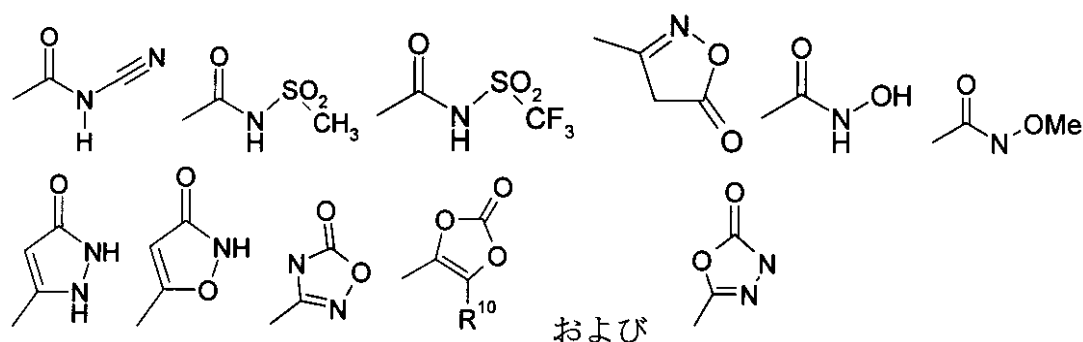
4) - O - R¹⁷、または

5) - (C₀ - C₆) - アルキル - ヘテロシクリル、ここにおいてアルキルおよびヘテロシクリルは互いに独立して非置換または R¹³ によって単、二または三置換されており、そしてここにおいてヘテロシクリルはアゼチジン、イミダゾリジン、モルホリン、4,5 - ジヒドロ - [1,2,4]オキサジアゾール、- [1,3]ジオキソール、(1,4) - オキサゼパンまたはピロリジンの群から選ばれるか、または

R¹¹ および R¹² は、それらが結合している窒素原子と一緒に環を形成することができ、これはアゼチジン、イミダゾリジン、モルホリン、(1,4) - オキサゼパン、ピペラジン、ピペリジン、ピロリジンまたはチオモルホリンの群から選ばれ、

R¹³ は、フッ素、- CN、= O、- OH、- CF₃、- C(O) - O - R¹⁰、- C(O) - N(R¹⁰) - R²⁰、- N(R¹⁰) - R²⁰、- (C₃ - C₆) - シクロアルキル、- (C₀ - C₃) - アルキレン - O - R¹⁰、- Si - (CH₃)₃、- S - R¹⁰、- SO₂ - R¹⁰、- SO₂ - NH、- (C₁ - C₃) - パーフフルオロアルキル、- (C₁ - C₃) - アルキル、または以下：

【化 7】



からの残基であり、ここにおいて Me はメチルであり、

R¹⁰ および R²⁰ は、互いに独立して水素、- (C₁ - C₄) - アルキルまたは - (C₁ - C₃) - パーフフルオロアルキルであり、

R¹⁵ および R¹⁶ は、互いに独立して水素、- (C₁ - C₄) - アルキルであるか、または一緒に環を形成し、ここにおいてそれぞれの環は非置換または R¹⁰ によって 1 ~ 3 回置換されており、そして

R¹⁷ は、- (C₁ - C₆) - アルキル、- (C₁ - C₆) - アルキル - OH、- (C₁ - C₆) - アルキル - O - (C₁ - C₆) - アルキル、- (C₃ - C₈) - シクロアルキル、- (C₁ - C₆) - アルキル - O - (C₁ - C₈) - アルキル - (C₃ - C₈) - シクロアルキル、- (C₁ - C₆) - アルキル - (C₃ - C₈) - シクロアルキルであり、ここにおいて該シクロアルキル環は非置換または - OH、- O - (C₁ - C₄) - アルキルまたは R¹⁰ によって 1、2 または 3 回置換されている、

請求項 1 または 2 に記載の式 I の化合物、その全ての立体異性体の形態、あらゆる比率におけるそれらの混合物、およびその生理学上許容しうる塩。

【請求項 4】

式 I の化合物は、

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

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

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

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

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

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

インダゾール - 1, 3 - ジカルボン酸 1 - [(5 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - アミド]
 3 - [(1 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イル) - アミド]、

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

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

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

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

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

1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル]
 - 1 H - インダゾール - 3, 5 - ジカルボン酸 3 - [(1 - イソプロピル - ピペリジン - 4
 - イル) - アミド] 5 - [(2 - メタンスルホニル - エチル) - アミド]、

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

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

1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル]
 - 1 H - インダゾール - 3, 5 - ジカルボン酸 3 - [(1 - イソプロピル - ピペリジン - 4
 - イル) - アミド] 5 - トリメチルシラニルメチルアミド、

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

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

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

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

- 1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル]
 - 1 H - インダゾール - 3, 5 - ジカルボン酸 5 - カルバモイルメチル - アミド 3 - [(1 -
 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イル) - アミド]、
- 1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル]
 - 1 H - インダゾール - 3, 5 - ジカルボン酸 5 - [(2 - ヒドロキシエチル) - アミド] 3
 - [(1 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イル) - アミド]、
- 1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル]
 - 1 H - インダゾール - 3, 5 - ジカルボン酸 3 - [(1 - イソプロピル - ピペリジン - 4
 - イル) - アミド] 5 - {[2 - (2 - オキソイミダゾリジン - 1 - イル) - エチル] - アミド
 }、
- 1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル]
 - 1 H - インダゾール - 3, 5 - ジカルボン酸 5 - [(2 - ヒドロキシ - 1 - ヒドロキシメ
 チル - 1 - メチル - エチル) - アミド] 3 - [(1 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イル)
 - アミド]、
- {[1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチ
 ル] - 3 - (1 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イルカルバモイル) - 1 H - インダゾー
 ル - 5 - カルボニル] - アミノ} - 酢酸、
- 1 - [1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメ
 チル] - 3 - (1 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イルカルバモイル) - 1 H - インダゾ
 ール - 5 - カルボニル] - (2 S) - アゼチジン - 2 - カルボン酸、
- 1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル]
 - 1 H - インダゾール - 3, 5 - ジカルボン酸 3 - [(1 - イソプロピル - ピペリジン - 4
 - イル) - アミド] 5 - [(2, 2, 2 - トリフルオロ - エチル) - アミド]、
- {[1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチ
 ル] - 3 - (1 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イルカルバモイル) - 1 H - インダゾー
 ル - 5 - カルボニル] - メチル - アミノ} - 酢酸、
- 1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル]
 - 3 - (1 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イルカルバモイル) - 1 H - インダゾール -
 5 - カルボン酸 2 - ヒドロキシ - エチルエステル、
- 1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル]
 - 5 - ([1, 4]オキサゼパン - 4 - カルボニル) - 1 H - インダゾール - 3 - カルボン酸 (1
 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イル) - アミド、
- 1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル]
 - 5 - (3 - ヒドロキシ - アゼチジン - 1 - カルボニル) - 1 H - インダゾール - 3 - カル
 ボン酸 (1 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イル) - アミド、
- 1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル]
 - 1 H - インダゾール - 3, 5 - ジカルボン酸 3 - [(1 - イソプロピル - ピペリジン - 4
 - イル) - アミド] 5 - (メトキシ - アミド)、
- 1 - [(5 - クロロ - ピリジン - 2 - イルカルバモイル) - メチル] - 1 H - インダゾール
 - 3 - カルボン酸 [4 - (ピペリジン - 1 - カルボニル) - フェニル] - アミド、
- 1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル]
 - 1 H - インダゾール - 3 - カルボン酸 [4 - (ピロリジン - 1 - カルボニル) - フェニル]
 - アミド、
- 1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル]
 - 1 H - インダゾール - 3 - カルボン酸 [4 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - フェニル]
 - アミド、
- 1 - [(5 - クロロ - ピリジン - 2 - イルカルバモイル) - メチル] - 1 H - インダゾール
 - 3 - カルボン酸 [4 - (モルホリン - 4 - カルボニル) - フェニル] - アミド、
- 1 - (1 - {1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 -
 イルメチル] - 1 H - インダゾール - 3 - カルボニル} - ピペリジン - 4 - イル) - ピロリ

ジン - 2 - オン、

N - (5 - クロロ - ピリジン - 2 - イル) - 2 - { 3 - [4 - (2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル) - ピペリジン - 1 - カルボニル] - インダゾール - 1 - イル } - アセトアミド、
1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - インダゾール - 3 - カルボン酸 [4 - (2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル) - フェニル] - アミド、

1 - [(5 - クロロ - ピリジン - 2 - イルカルバモイル) - メチル] - 1 H - インダゾール - 3 - カルボン酸 [4 - (2 - オキソ - ピロリジン - 1 - イル) - フェニル] - アミド、

1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - インダゾール - 3 - カルボン酸 (2' - メタンスルホニル - ビフェニル - 4 - イル) - アミド、

1 - [(5 - クロロ - ピリジン - 2 - イルカルバモイル) - メチル] - 1 H - インダゾール - 3 - カルボン酸 (2' - メタンスルホニル - ビフェニル - 4 - イル) - アミド、

1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - インダゾール - 3 - カルボン酸 [4 - (4 - メチル - 6 - オキソ - 1, 4, 5, 6 - テトラヒドロ - ピリダジン - 3 - イル) - フェニル] - アミド、

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

1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - インダゾール - 3 - カルボン酸 [4 - (1 H - イミダゾール - 4 - イル) - フェニル] - アミド、

1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - インダゾール - 3 - カルボン酸 (4 - ピペリジン - 1 - イル - フェニル) - アミド、

1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 3 - [4 - (3 - オキソ - モルホリン - 4 - イル) - フェニルカルバモイル] - 1 H - インダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステル、

1 - [(5 - クロロ - ピリジン - 2 - イルカルバモイル) - メチル] - 3 - (1 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イルカルバモイル) - 1 H - インダゾール - 5 - カルボン酸メチルエステル、

1 - [(5 - クロロ - ピリジン - 2 - イルカルバモイル) - メチル] - 3 - (1 - イソプロピル - ピペリジン - 4 - イルカルバモイル) - 1 H - インダゾール - 5 - カルボン酸、

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

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

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

1 - [(5 - クロロ - ピリジン - 2 - イルカルバモイル) - メチル] - 1 H - インダゾール - 3 - カルボン酸 [4 - (3 - オキソ - モルホリン - 4 - イル) - フェニル] - アミド、

1 - [5 - (5 - クロロ - チオフェン - 2 - イル) - イソオキサゾール - 3 - イルメチル] - 1 H - インダゾール - 3 - カルボン酸 [4 - (4 - オキソ - 4 H - ピリジン - 1 - イル) - フェニル] - アミド、

1 - [(5 - クロロ - ピリジン - 2 - イルカルバモイル) - メチル] - 1 H - インダゾール - 3 - カルボン酸 [4 - (4 - オキソ - 4 H - ピリジン - 1 - イル) - フェニル] - アミド、

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

1 - [(5 - クロロ - ピリジン - 2 - イルカルバモイル) - メチル] - 3 - (1 - イソプロ
ピル - ピペリジン - 4 - イルカルバモイル) - 1 H - インダゾール - 5 - カルボン酸 2 -
ヒドロキシエチルエステルまたは

1 - [(5 - クロロ - ピリジン - 2 - イルカルバモイル) - メチル] - 5 - ([1, 4]オキサ
ゼパン - 4 - カルボニル) - 1 H - インダゾール - 3 - カルボン酸 (1 - イソプロピル -
ピペリジン - 4 - イル) - アミド

である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の式 I の化合物。

【請求項 5】

請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 つの式 I の化合物、その全ての立体
異性体形態、あらゆる比率におけるそれらの混合物および / またはその生理学上許容しう
る塩、並びに医薬上許容しうる担体を含んでなる医薬製剤。