

【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10月19日(2006.10.19)

【公表番号】特表2006-516266(P2006-516266A)
 【公表日】平成18年6月29日(2006.6.29)
 【年通号数】公開・登録公報2006-025
 【出願番号】特願2005-512867(P2005-512867)
 【国際特許分類】

C 0 7 D 231/56 (2006.01)
A 6 1 K 31/454 (2006.01)
A 6 1 K 31/416 (2006.01)
A 6 1 K 31/496 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/14 (2006.01)
A 6 1 P 3/04 (2006.01)
A 6 1 P 3/00 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 P 9/12 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 15/08 (2006.01)
A 6 1 P 37/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)
A 6 1 P 25/16 (2006.01)
C 0 7 F 7/10 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 231/56 C S P F
 A 6 1 K 31/454
 A 6 1 K 31/416
 A 6 1 K 31/496
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 25/14
 A 6 1 P 3/04
 A 6 1 P 3/00
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 9/12
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 15/08
 A 6 1 P 37/00
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/16
 C 0 7 F 7/10 S

【手続補正書】
 【提出日】平成18年8月30日(2006.8.30)
 【手続補正1】
 【補正対象書類名】特許請求の範囲
 【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

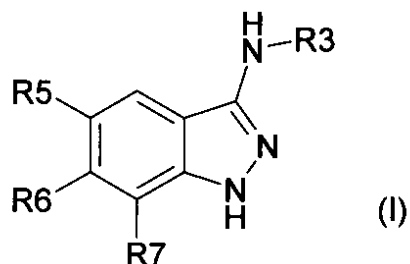
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



[式中、

R3は(1-6C)アルキル、アリール、アリール(1-6C)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール(1-6C)アルキル、(1-10C)シクロアルキルに融合したアリール若しくはヘテロアリール、複素環、ヘテロシクロアルキル、シクロアルキル、アダマンチル、ポリシクロアルキル、アルケニル、アルキニル、CONR₁R₂、CSNR₁R₂、COOR₁、SO₂R₁、C(=NH)R₁、又はC(=NH)NR₁基であり；これらの基は場合によっては、ハロゲン、CN、NO₂、NH₂、OH、OR₁、COOH、C(O)OR₁、-O-C(O)R₁、NR₁R₂、NHC(O)R₁、C(O)NR₁R₂、SR₁、S(O)R₁、SO₂R₁、NH₂SO₂R₁、SO₂NR₁R₂、C(S)NR₁R₂、NHC(S)R₁、-O-SO₂R₁、-SO₂-O-R₁、アリール、ヘテロアリール、複素環、ホルミル、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメトキシ又は(1-6C)アルキルから選ばれた1又はそれ以上の置換基で置換され；

R5、R6及びR7は互いに独立して下記の基：ハロゲン、CN、NO₂、NH₂、OH、COOH、C(O)OR₈、-O-C(O)R₈、NR₈R₉、NHC(O)R₈、C(O)NR₈R₉、NHC(S)R₈、C(S)NR₈R₉、SR₈、S(O)R₈、SO₂R₈、NH₂SO₂R₈、SO₂NR₈R₉、-O-SO₂R₈、-SO₂-O-R₈、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ、アリール、アリール(1-6C)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール(1-6C)アルキル、複素環、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アダマンチル又はポリシクロアルキルから選ばれ；これらの基は場合によってはハロゲン、CN、NO₂、NH₂、OH、OR₁₀、COOH、C(O)OR₁₀、-O-C(O)R₁₀、NR₁₀R₁₁、NHC(O)R₁₀、C(O)NR₁₀R₁₁、NHC(S)R₁₀、C(S)NR₁₀R₁₁、SR₁₀、S(O)R₁₀、SO₂R₁₀、NH₂SO₂R₁₀、SO₂NR₁₀R₁₁、-O-SO₂R₁₀、-SO₂-O-R₁₀、アリール、ヘテロアリール、ホルミル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ又は(1-6C)アルキルから選ばれる1又はそれ以上の置換基で置換され；

R1、R2、R8、R9、R10及びR11は互いに独立して水素、(1-6C)アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、又はヘテロアリールであり、それらは場合によってはハロゲン、(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ、CN、NO₂、NH₂、OH、COOH、COOアルキル、CONH₂、ホルミル、トリフルオロメチル、及びトリフルオロメトキシから選ばれる1又はそれ以上の置換基で置換され；

R1とR2又はR8とR9又はR10とR11は、ヘテロ原子O、S又はNを有しても有しなくてもよい5-又は6-員環を形成することができ；

そしてR3が6-員窒素ヘテロアリール又はチアゾリル又はイミダゾリル又はオキサゾリルである場合は、R5及びR6基の少なくとも一つは、場合によってはハロゲン、CN

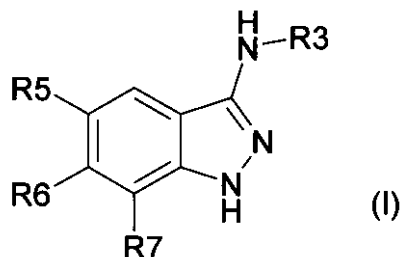
、 NO_2 、 NH_2 、 OH 、 OR_{10} 、 COOH 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $\text{NHC}(\text{S})\text{R}_{10}$ 、 $\text{C}(\text{S})\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 SR_{10} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}_{10}$ 、 SO_2R_{10} 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}_{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{O}-\text{SO}_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{O}-\text{R}_{10}$ 、アリーール、ヘテロアリーール、ホルミル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ又は(1-6C)アルキルから選ばれる1又はそれ以上の置換基で置換されるアリーールである]

の化合物、そのラセミ体、エナンチオマー又はジアステレオマー及びそれらの混合物、その互変異性体、ならびにその薬学的に許容される塩。

【請求項2】

式(I)：

【化2】



[式中、

R3は(1-6C)アルキル、アリーール、アリーール(1-6C)アルキル、ヘテロアリーール、ヘテロアリーール(1-6C)アルキル、(1-10C)シクロアルキルに融合したアリーール若しくはヘテロアリーール、複素環、ヘテロシクロアルキル、シクロアルキル、アダマンチル、ポリシクロアルキル、アルケニル、アルキニル、 CONR_1R_2 、 CSNR_1R_2 、 COOR_1 、 SO_2R_1 、 $\text{C}(=\text{NH})\text{R}_1$ 、又は $\text{C}(=\text{NH})\text{NR}_1$ 基であり；これらの基は場合によっては、ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 NH_2 、 OH 、 OR_1 、 COOH 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}_1$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})\text{R}_1$ 、 NR_1R_2 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}_1$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}_1\text{R}_2$ 、 SR_1 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}_1$ 、 SO_2R_1 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}_1$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}_1\text{R}_2$ 、 $\text{C}(\text{S})\text{NR}_1\text{R}_2$ 、 $\text{NHC}(\text{S})\text{R}_1$ 、 $-\text{O}-\text{SO}_2\text{R}_1$ 、 $-\text{SO}_2-\text{O}-\text{R}_1$ 、アリーール、ヘテロアリーール、複素環、ホルミル、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメトキシ又は(1-6C)アルキルから選ばれた1又はそれ以上の置換基で置換され；

R5及びR6は互いに独立して下記の基：ハロゲン、 CN 、 NO_2 、 NH_2 、 OH 、 COOH 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}_8$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})\text{R}_8$ 、 NR_8R_9 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}_8$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $\text{NHC}(\text{S})\text{R}_8$ 、 $\text{C}(\text{S})\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 SR_8 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}_8$ 、 SO_2R_8 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}_8$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}_8\text{R}_9$ 、 $-\text{O}-\text{SO}_2\text{R}_8$ 、 $-\text{SO}_2-\text{O}-\text{R}_8$ 、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ、アリーール、アリーール(1-6C)アルキル、ヘテロアリーール、ヘテロアリーール(1-6C)アルキル、複素環、シクロアルキル、アルケニル、アルキニル、アダマンチル又はポリシクロアルキルから選ばれ；これらの基は場合によってはハロゲン、 CN 、 NO_2 、 NH_2 、 OH 、 OR_{10} 、 COOH 、 $\text{C}(\text{O})\text{OR}_{10}$ 、 $-\text{O}-\text{C}(\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $\text{NHC}(\text{O})\text{R}_{10}$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $\text{NHC}(\text{S})\text{R}_{10}$ 、 $\text{C}(\text{S})\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 SR_{10} 、 $\text{S}(\text{O})\text{R}_{10}$ 、 SO_2R_{10} 、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{R}_{10}$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ 、 $-\text{O}-\text{SO}_2\text{R}_{10}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{O}-\text{R}_{10}$ 、アリーール、ヘテロアリーール、ホルミル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ又は(1-6C)アルキルから選ばれる1又はそれ以上の置換基で置換され；

R7はハロゲン、メチル、シクロプロピル、 CN 、 OH 、メトキシ、トリフルオロメチル、エチレニル、アセチレニル、トリフルオロメトキシ、 NO_2 、 NH_2 又は NMe_2 であり；

R1、R2、R8、R9、R10及びR11は互いに独立して水素、(1-6C)アル

キル、アリール、アルケニル、アルキニル、又はヘテロアリールであり、それらは場合によってはハロゲン、(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ、CN、NO₂、NH₂、OH、COOH、COOアルキル、CONH₂、ホルミル、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシから選ばれる1又はそれ以上の置換基で置換され；

R1とR2又はR8とR9又はR10とR11は、ヘテロ原子O、S又はNを有しても有しなくてもよい5-又は6-員環を形成することができ；

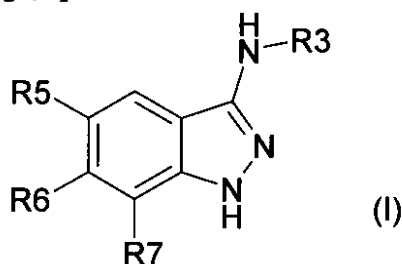
そしてR3が6-員窒素ヘテロアリール又はチアゾリル又はイミダゾリル又はオキサゾリルである場合は、R5及びR6基の少なくとも一つは、場合によってはハロゲン、CN、NO₂、NH₂、OH、OR10、COOH、C(O)OR10、-O-C(O)R10、NR10R11、NHC(O)R10、C(O)NR10R11、NHC(S)R10、C(S)NR10R11、SR10、S(O)R10、SO₂R10、NH₂SO₂R10、SO₂NR10R11、-O-SO₂R10、-SO₂-O-R10、アリール、ヘテロアリール、ホルミル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ及び(1-6C)アルキルから選ばれる1又はそれ以上の置換基で置換されるアリールである]

の化合物、そのラセミ体、エナンチオマー又はジアステレオマー及びそれらの混合物、その互変異性体、ならびにその薬学的に許容される塩。

【請求項3】

式(I)：

【化3】



[式中、

R3は(1-6C)アルキル、アリール、アリール(1-6C)アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール(1-6C)アルキル、(1-10C)シクロアルキルに融合したアリール若しくはヘテロアリール、複素環、ヘテロシクロアルキル、シクロアルキル、アダマンチル、ポリシクロアルキル、アルケニル、アルキニル、CONR1R2、CSNR1R2、COOR1、SO₂R1、又はC(=NH)NR1基であり；これらの基は場合によっては、ハロゲン、CN、NO₂、NH₂、OH、OR1、COOH、C(O)OR1、-O-C(O)R1、NR1R2、NHC(O)R1、C(O)NR1R2、SR1、S(O)R1、SO₂R1、NH₂SO₂R1、SO₂NR1R2、C(S)NR1R2、NHC(S)R1、-O-SO₂R1、-SO₂-O-R1、アリール、ヘテロアリール、ホルミル、オキソ、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメトキシ又は(1-6C)アルキルから選ばれた1又はそれ以上の置換基で置換され；

R5はアリールであり；

R6及びR7は互いに独立してハロゲン、メチル、シクロプロピル、CN、OH、メトキシ、トリフルオロメチル、エチレニル、アセチレニル、トリフルオロメトキシ、NO₂、NH₂又はNMe₂であり；

R1及びR2は互いに独立して水素、(1-6C)アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、又はヘテロアリールであり、それらは場合によってはハロゲン、(1-6C)アルキル、(1-6C)アルコキシ、CN、NO₂、NH₂、OH、COOH、COOアルキル、CONH₂、ホルミル、オキソ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシから選ばれる1又はそれ以上の置換基で置換され；

R1及びR2はヘテロ原子O、S又はNを有しても有しなくてもよい5-又は6-員環を形成することができる]

の化合物、そのラセミ体、エナンチオマー、ジアステレオマー及びそれらの混合物、その互変異性体、ならびにその薬学的に許容される塩。

【請求項4】

下記の化合物：

N - (ビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプタ - 5 - エン - 2 - イルメチル) - 6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (3 , 3 - ジメチルブチル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (3 - フェニルプロピル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (シクロプロピルメチル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (シクロペンチルメチル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [3 - (メチルチオ) プロピル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (フェニルエチル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (シクロヘキシルメチル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - プロピル - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (2 , 2 , 3 , 3 , 4 , 4 , 4 - ヘプタフルオロブチル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン水和物

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (4 , 4 , 4 - トリフルオロブチル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [(4 - メトキシフェニル) メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (フェニルメチル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [(4 - シアノフェニル) メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

N - [(4 - クロロフェニル) メチル] - 6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [(3 - メトキシフェニル) メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [[4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル] メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

N - [4 - [[[6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アミノ] メチル] フェニル] アセトアミド

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [(3 , 5 - ジクロロフェニル) メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - [[4 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル] - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [(4 - フルオロフェニル) メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [3 - (4 - メチルフェノキシ) フェニルメチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

N - (2 , 2 , 3 , 3 , 4 , 4 , 4 - ヘプタフルオロブチル) - 6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - [[3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル] メチル] - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - [[3 - (トリフルオロメチル) フェニル] メチル] - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [(6 - メトキシ - 2 - ナフチル) メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [(ベンタフルオロフェニル) メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [[4 - (メチルチオ) フェニル] メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

N - [(4 - クロロ - 3 - フルオロフェニル) メチル] - 6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - (3 , 3 , 3 - トリフルオロプロピル) - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - (3 - チエニルメチル) - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

N - (ビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプタ - 5 - エン - 2 - イルメチル) - 6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

N - (1 , 1 ' - ビフェニル - 4 - イルメチル) - 6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [[4 - (ジメチルアミノ) フェニル] メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

N - (2 , 2 ' - ピチオフエン - 5 - イルメチル) - 6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - [[1 - (フェニルメチル) - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] メチル] - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [[1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - イル] メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [(1 - メチル - 1 H - インドール - 3 - イル) メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [(5 - メチル - 2 - フラニル) メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - (1 H - ピロール - 2 - イルメチル) - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - [(1 H - イミダゾール - 2 - イル) メチル] - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - [(1 H - イミダゾール - 4 - イル) メチル] - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - (1 H - ピラゾール - 3 - イルメチル) - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [[2 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [(3 , 5 - ジメチル - 1 - フェニル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - [[2 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] メチル] - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [[5 - (4 - クロロフェニル) - 2 - フラニル] メチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - [(1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - イル) メチル] - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

4 - [5 - [[[6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アミノ] メチル] - 2 - フラニル] - ベンゼンスルホンアミド
 6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - (3 - チェニルメチル) - 1 H - インダゾール - 3 - アミン
 6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - [[2 - フェニル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル] メチル] - 1 H - インダゾール - 3 - アミン
 2 - [[[6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] アミノ] メチル] - 5 - (メチルチオ) - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸エチル
 6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - [[5 - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 2 - フラニル] メチル] - 1 H - インダゾール - 3 - アミン
 6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - [2 - (1 - ピペリジニル) エチル] - 1 H - インダゾール - 3 - アミン
 6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [2 - (4 - モルホリニル) エチル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン
 N - (6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (3, 5 - ジクロロフェニル) 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (2 - プロペニル) 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (フェニルメチル) 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - 4 - (フェノキシフェニル) 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - [(4 - メトキシフェニル) メチル] 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (4 - メトキシフェニル) 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - シクロヘキシル 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - プロピル 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (4 - クロロフェニル) 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (4 - フルオロフェニル) 尿素
 N - [6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - N' - (トリシクロ [3 . 3 . 1 . 1^{3,7}] デカ) - 1 - イル 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - (4 - メチルフェニル) 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - メチル - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - シアノ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - シクロプロピル - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - ヒドロキシ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素
 N - (6 - クロロ - 7 - メトキシ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素

- N - (6 - クロロ - 7 - トリフルオロメチル - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素
- N - (6 - クロロ - 7 - トリフルオロメトキシ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素
- N - (6 - クロロ - 7 - ニトロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素
- N - (6 - クロロ - 7 - アミノ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素
- N - (6 - クロロ - 7 - ジメチルアミノ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素
- N - (6 - クロロ - 7 - エチニル - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) 尿素
- N - [6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - メチル - ベンゼンスルホンアミド
- N - [6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] メタンズルホンアミド
- N - [6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - プロパンスルホンアミド
- N - [6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2, 2, 2 - トリフルオロエタンズルホンアミド
- N - [6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 2 - チオフェンスルホンアミド
- N - [6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンゼンスルホンアミド
- N - [6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (トリフルオロメチル) ベンゼンスルホンアミド
- N - [6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 5 - (3 - イソオキサゾリル) - 2 - チオフェンスルホンアミド
- N - [6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - フルオロベンゼンスルホンアミド
- N - [6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - メトキシベンゼンスルホンアミド
- N - [6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] ベンゼンメタンズルホンアミド
- N - [6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - スルホンアミド
- N - [6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - (1, 1 - ジメチルエチル) ベンゼンスルホンアミド
- N - [4 - [[(6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アミノ] スルホニル] フェニル] - アセトアミド
- N - [6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル] - 4 - メチルベンゼンメタンズルホンアミド
- 6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (ペンタフルオロフェニル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン
- 6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (3, 4 - ジフルオロフェニル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン
- 6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - (2, 3, 5, 6 - テトラフルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - アミン
- 6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - N - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 1 H - インダゾール - 3 - アミン
- 6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (4 - フルオロフェニル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [3 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - [3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (4 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (3 - ニトロフェニル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (3 - メトキシフェニル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (4 - メトキシフェニル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N , 5 - ジフェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (1 - ピリジニル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

6 - クロロ - 7 - フルオロ - N - (2 - ピリジニル) - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

N - ブチル - 6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン

N - (6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - N' - フェニル尿素

N - (6 - クロロ - 7 - フルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 - メトキシベンゼンスルホンアミド

から選ばれる請求項 1 記載の化合物、それらのラセミ体、エナンチオマー若しくはジアステレオマー及びそれらの混合物、それらの互変異性体、ならびにそれらの薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

下記の化合物：

ピペリジン - 1 - カルボン酸 (6 , 7 - ジフルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アミド

ピロリジン - 1 - カルボン酸 (6 , 7 - ジフルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) アミド

1 - (6 , 7 - ジフルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - イル) - 3 - [3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - プロピル] 尿素

から選ばれる請求項 1 又は 2 記載の化合物、その互変異性体、及びそれらの薬学的に許容される塩。

【請求項 6】

薬学的に許容される媒体中に請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 7】

請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項記載の化合物の少なくとも一つを、タウタンパク質のリン酸化反応が観察される疾病の治療における治療用途に含む、請求項 6 記載の医薬組成物。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項記載の化合物の少なくとも一つを、神経変性疾病、発作、頭及び背骨の外傷及び末梢神経障害、肥満、代謝性疾患、II型糖尿病、本態性高血圧、アテローム性心臓血管疾患、多嚢胞性卵巣症候群、症候群 X、免疫不全及び癌の治療における治療用途に含む、請求項 6 記載の医薬組成物。

【請求項 9】

神経変性疾病がアルツハイマー病、パーキンソン病、前頭頭頂痴呆、大脳皮質基底核変性症又はピック病である、請求項 8 記載の医薬組成物。

【請求項 10】

R3 が (1-6C) アルキル、アリール (1-6C) アルキル、ヘテロアリール (1-6C) アルキル、ヘテロシクロアルキル、シクロアルキル又はポリシクロアルキルであり、これらの基は場合によっては、ハロゲン、CN、NO₂、NH₂、OH、OR1、COOH、C(O)OR1、-O-C(O)R1、NR1R2、NHC(O)R1、C(O)NR1R2、SR1、S(O)R1、SO₂R1、NHSO₂R1、SO₂NR1R2、C(S)NR1R2、NHC(S)R1、-O-SO₂R1、-SO₂-O-R1、アリール、ヘテロアリール、ホルミル、オキソ、トリフルオロメチル、トリフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメトキシ又は (1-6C) アルキルから選ばれた 1 又はそれ以上の置換基で置換され、そして R1 及び R2 は互いに独立して水素、(1-6C) アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、又はヘテロアリールであり、それらは場合によってはハロゲン、(1-6C) アルキル、(1-6C) アルコキシ、CN、NO₂、NH₂、OH、COOH、COOアルキル、CONH₂、ホルミル、オキソ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシから選ばれる 1 又はそれ以上の置換基で置換される基である請求項 1 記載の式 (I) の化合物の製造法であって、R3 が H である式 (I) の誘導体、R1CHO の誘導体及びトリアセトキシホウ水素化ナトリウムからジクロロメタン中で該化合物を製造し、そして得られた生成物を場合によっては薬学的に許容される塩に変換する製造法。

【請求項 11】

R3 が CONR1R2 又は CSNR1R2 であり、そして R1 及び R2 が互いに独立して水素、(1-6C) アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、又はヘテロアリールであり、それらは場合によってはハロゲン、(1-6C) アルキル、(1-6C) アルコキシ、CN、NO₂、NH₂、OH、COOH、COOアルキル、CONH₂、ホルミル、オキソ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシから選ばれる 1 又はそれ以上の置換基で置換される基である請求項 1 記載の式 (I) の化合物の製造法であって、OCNR1 及び R3 が H である式 (I) の誘導体からテトラヒドロフラン中で該化合物を製造し、そして得られた生成物を場合によっては薬学的に許容される塩に変換する製造法。

【請求項 12】

R3 が SO₂R1 であり、そして R1 が水素、(1-6C) アルキル、アリール、アルケニル、アルキニル、又はヘテロアリールであり、それらは場合によってはハロゲン、(1-6C) アルキル、(1-6C) アルコキシ、CN、NO₂、NH₂、OH、COOH、COOアルキル、CONH₂、ホルミル、オキソ、トリフルオロメチル又はトリフルオロメトキシから選ばれる 1 又はそれ以上の置換基で置換される基である請求項 1 記載の式 (I) の化合物の製造法であって、塩化スルホニル R1SO₂Cl 及び R3 が H である及び式 (I) の誘導体からジクロロメタン中、塩基の存在下で該化合物を製造し、そして得られた化合物を場合によっては薬学的に許容される塩に変換する製造法。

【請求項 13】

中間生成物としての下記の化合物：

6,7-ジフルオロ-1H-インダゾール-3-アミン

N-(6,7-ジフルオロ-1H-インダゾール-3-イル)ブタンアミド

N-[6,7-ジフルオロ-1-[[2-(トリメチルシリル)エトキシ]メチル]-1H-インダゾール-3-イル]ブタンアミド

N-[5-プロモ-6,7-ジフルオロ-1-[[2-(トリメチルシリル)エトキシ]メチル]-1H-インダゾール-3-イル]ブタンアミド

N-[6,7-ジフルオロ-5-フェニル-1-[[2-(トリメチルシリル)エトキシ]メチル]-1H-インダゾール-3-イル]ブタンアミド

6,7-ジフルオロ-5-フェニル-1-[[2-(トリメチルシリル)エトキシ]メチル]-1H-インダゾール-3-アミン

6,7 - ジフルオロ - 5 - フェニル - 1 H - インダゾール - 3 - アミン。