

【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21年11月26日(2009.11.26)

【公開番号】特開2009-221205(P2009-221205A)

【公開日】平成21年10月1日(2009.10.1)

【年通号数】公開・登録公報2009-039

【出願番号】特願2009-110392(P2009-110392)

【国際特許分類】

C 07 D 209/42 (2006.01)
A 61 P 35/00 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 13/10 (2006.01)
A 61 P 15/14 (2006.01)
A 61 P 1/04 (2006.01)
A 61 P 19/00 (2006.01)
A 61 P 15/00 (2006.01)
A 61 P 13/00 (2006.01)
A 61 P 35/02 (2006.01)
A 61 P 1/16 (2006.01)
A 61 P 21/00 (2006.01)
A 61 P 11/00 (2006.01)
A 61 P 13/08 (2006.01)
A 61 P 13/12 (2006.01)
A 61 P 3/10 (2006.01)
A 61 P 37/02 (2006.01)
A 61 P 25/28 (2006.01)
A 61 P 27/02 (2006.01)
A 61 P 17/06 (2006.01)
A 61 P 19/02 (2006.01)
A 61 P 29/00 (2006.01)
A 61 P 9/00 (2006.01)
A 61 K 45/00 (2006.01)
A 61 K 31/5377 (2006.01)
A 61 K 31/496 (2006.01)
A 61 K 31/454 (2006.01)
A 61 K 31/404 (2006.01)
A 61 K 31/541 (2006.01)
C 07 D 413/12 (2006.01)
C 07 D 403/12 (2006.01)
A 61 K 31/5513 (2006.01)
C 07 D 491/044 (2006.01)
A 61 K 31/407 (2006.01)
C 07 D 405/04 (2006.01)
C 07 D 409/04 (2006.01)
C 07 D 403/04 (2006.01)
C 07 D 401/04 (2006.01)
C 07 D 413/04 (2006.01)
C 07 D 417/04 (2006.01)
C 07 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 487/10 (2006.01)
C 0 7 D 513/04 (2006.01)
C 0 7 D 417/14 (2006.01)
C 0 7 D 401/12 (2006.01)
C 0 7 D 498/18 (2006.01)
A 6 1 K 31/5386 (2006.01)
C 0 7 D 513/18 (2006.01)
A 6 1 K 31/547 (2006.01)
C 0 7 D 491/16 (2006.01)
A 6 1 K 31/438 (2006.01)
C 0 7 D 487/20 (2006.01)
C 0 7 D 401/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 209/42 C S P

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 13/10

A 6 1 P 15/14

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 19/00

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 13/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/541

C 0 7 D 413/12

C 0 7 D 403/12

A 6 1 K 31/5513

C 0 7 D 491/044

A 6 1 K 31/407

C 0 7 D 405/04

C 0 7 D 409/04

C 0 7 D 403/04
 C 0 7 D 401/04
 C 0 7 D 413/04
 C 0 7 D 417/04
 C 0 7 D 413/14
 C 0 7 D 487/10
 C 0 7 D 513/04 3 3 1
 C 0 7 D 417/14
 C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 498/18
 A 6 1 K 31/5386
 C 0 7 D 513/18
 A 6 1 K 31/547
 C 0 7 D 491/16
 A 6 1 K 31/438
 C 0 7 D 487/20
 C 0 7 D 401/14

【手続補正書】

【提出日】平成21年10月8日(2009.10.8)

【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

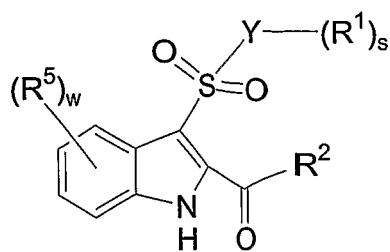
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式Iの化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは立体異性体。

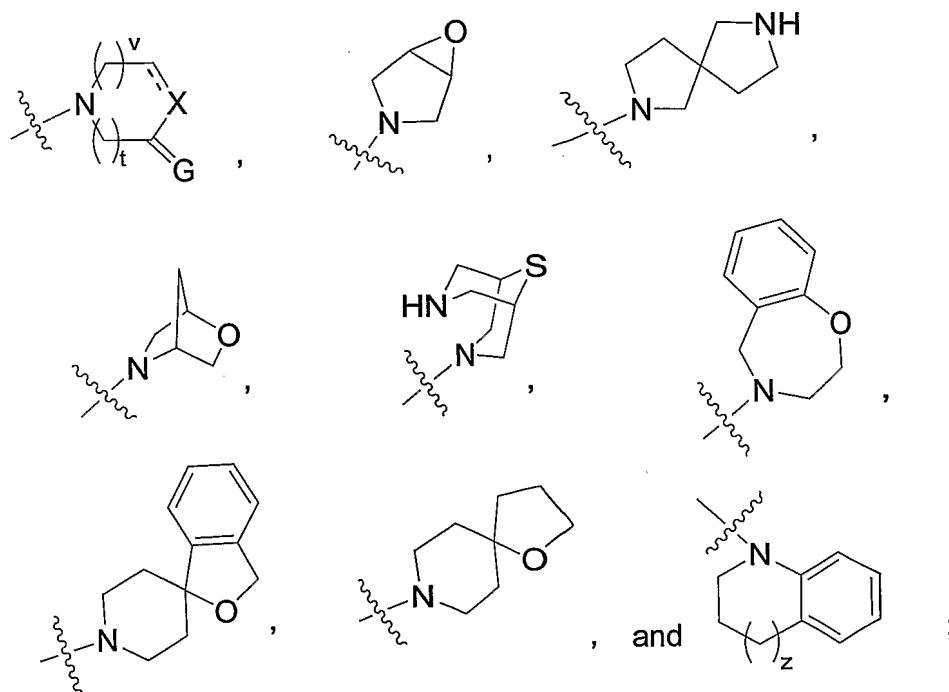
【化151】



[式中、

Yは、

【化152】



から選択され；

- - - - - は、存在しても良い二重結合を表し；

Xは、C、N、S(O)_mまたはOであり；Gは、H₂またはOであり；R^aは独立に、

- 1) H、
- 2) C₁ ~ C₆ アルキル、
- 3) ハロゲン、
- 4) アリール、
- 5) 複素環、
- 6) C₃ ~ C₁₀ シクロアルキルまたは
- 7) OR⁴

から選択され；

前記アルキル、アリール、複素環およびシクロアルキルは、R⁷から選択される少なくとも1個の置換基で場合によっては置換されていても良く；R¹は独立に、

- 1) H、
- 2) (CR^a)_nR⁶、
- 3) (CR^a)_nC(O)R⁴、
- 4) C(O)N(R⁴)₂、
- 5) (CR^a)_nOR⁴、
- 6) (CR^a)_nN(R⁴)₂、
- 7) S(O)_mR⁶、
- 8) S(O)_mR⁶OR⁴、
- 9) C(O)N(R⁴)(CR^a)_nR⁶、
- 10) C(O)N(R⁴)(CR^a)_nOR⁴、
- 11) C(O)R⁶(CR^a)_nR⁶、
- 12) C(O)N(R⁴)(CR^a)_nS(O)_m(CR^a)_nR⁶、
- 13) C(O)N(R⁴)(CR^a)_nC(O)R⁶、
- 14) C(O)N(R⁴)(CR^a)_nN(R⁴)₂、

15) ハロゲン、

16) $N(R^4)S(O)_mR^6$ および

17) $(CR^a_2)_nC(O)OR^4$

から選択され；

R^2 は、

1) H、

2) 未置換もしくは置換 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、

3) $N(R^4)_2$ 、

4) OR^4 、

5) 未置換もしくは置換アリール、および

6) 未置換もしくは置換 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル

であり；

R^4 は独立に、

1) H、

2) $C_1 \sim C_6$ アルキル、

3) $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、

4) アリール、

5) 複素環、

6) CF_3 、

7) $C_2 \sim C_6$ アルケニル、および

8) $C_2 \sim C_6$ アルキニル

から選択され；

前記アルキル、シクロアルキル、アリール、複素環、アルケニルおよびアルキニルは、
 R^7 から選択される少なくとも 1 個の置換基で場合によっては置換されていても良く；

R^5 は独立に、

1) H、

2) ハロゲン、

3) NO_2 、

4) CN 、

5) $CR^4 = C(R^4)_2$ 、

6) CCR^4 、

7) $(CR^a_2)_nOR^4$ 、

8) $(CR^a_2)_nN(R^4)_2$ 、

9) $C(O)R^4$ 、

10) $C(O)OR^4$ 、

11) $(CR^a_2)_nR^4$ 、

12) $S(O)_mR^6$ 、

13) $S(O)_mN(R^4)_2$ 、

14) $OS(O)_mR^6$ 、

15) $N(R^4)C(O)R^4$ 、

16) $N(R^4)S(O)_mR^6$ 、

17) $(CR^a_2)_nN(R^4)R^6$ 、

18) $(CR^a_2)_nN(R^4)R^6OR^4$ 、

19) $(CR^a_2)_nN(R^4)(CR^a_2)_nC(O)N(R^4)_2$ 、

20) $N(R^4)(CR^a_2)_nR^6$ 、

21) $N(R^4)(CR^a_2)_nN(R^4)_2$ 、

22) $(CR^a_2)_nC(O)N(R^4)_2$ 、

23) $O(CR^a_2)_nC(O)OR^4$ 、および

24) $O(CR^a_2)_nC(O)N(R^4)_2$

から選択され；

R^6 は独立に、

- 1) $C_1 \sim C$ アルキル、
 - 2) アリール、
 - 3) 複素環、および
 - 4) $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル
- から選択され；

前記アルキル、アリール、複素環およびシクロアルキルは少なくとも1個の R^7 置換基で場合によっては置換されていても良く；

R^7 は独立に、

- 1) 未置換もしくは置換 $C_1 \sim C_6$ アルキル、
- 2) ハロゲン、
- 3) OR^4 、
- 4) CF_3 、
- 5) 未置換もしくは置換アリール、
- 6) 未置換もしくは置換 $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、
- 7) 未置換もしくは置換複素環、
- 8) $S(O)_m N(R^4)_2$ 、
- 9) $C(O)OR^4$ 、
- 10) $C(O)R^4$ 、
- 11) CN 、
- 12) $C(O)N(R^4)_2$ 、
- 13) $N(R^4)C(O)R^4$ 、
- 14) NO_2 および
- 15) $S(O)_m R^6$

から選択され；

m は独立に、0、1または2であり；

n は独立に、0、1、2、3、4、5または6であり；

s は0～6であり；

t は0、1または2であり；

v は0、1または2であり；

w は0、1、2、3または4であり；

z は1または2である。]

ただし、

5 - クロロ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - ブロモ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - ヨード - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - メトキシ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド；

6 - メトキシ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - (メチルスルホニル) - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド；

7 - アミノ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド；

3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 5 - ニトロ - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - クロロ - 3 - (ピペラジン - 1 - イルスルホニル) - 1H - インドール - 2 - カル

ボキサミド；

3 - [(4 - ベンジルピペラジン - 1 - イル) スルホニル] - 5 - クロロ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

3 - [(4 - アセチルピペラジン - 1 - イル) スルホニル] - 5 - クロロ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - クロロ - 3 - (ピペリジン - 1 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - クロロ - 3 - (ピロリジン - 1 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - クロロ - 3 - (チオモルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

3 - (アゼチジン - 1 - イルスルホニル) - 5 - クロロ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - クロロ - 3 - [(オキシドチオモルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - クロロ - 3 - [(1 , 1 - ジオキシドチオモルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

シス - 5 - クロロ - 3 - (2 , 6 - ジメチルモルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

トランス - 5 - クロロ - 3 - (2 , 6 - ジメチルモルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - クロロ - 3 - [(3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

(±) - 5 - クロロ - 3 - { [2 - (フエノキシメチル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

(S) - 5 - クロロ - 3 - { [2 - (フエノキシメチル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

(R) - 5 - クロロ - 3 - { [2 - (フエノキシメチル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - ブロモ - 3 - { 4 - [2 - (ジメチルアミノ) エチル] - 5 - オキソ - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - ブロモ - 3 - ({ 5 - オキソ - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - ブロモ - 3 - [(3 - オキソピペラジン - 1 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - ブロモ - 3 - [(3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

(±) - 5 - ブロモ - 3 - { [2 - (アミノカルボニル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

3 - (アゼチジン - 1 - イルスルホニル) - 5 - ブロモ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - ブロモ - 3 - ({ 4 - [(4 - メトキシフェニル) スルホニル] ピペラジン - 1 - イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - ブロモ - 3 - ({ 4 - [(4 - ブロモフェニル) スルホニル] ピペラジン - 1 - イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - ブロモ - 3 - { [4 - (3 - モルホリン - 4 - イルプロピル) - 3 - オキソピペラジン - 1 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - ブロモ - 3 - ({ 4 - [3 - (ジメチルアミノ) ブロビル] - 3 - オキソピペラジン - 1 - イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド；

5 - ブロモ - 3 - (2 , 5 - ジヒドロキシ - 1 H - ピロール - 1 - イルスルホニル) -

1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - ブロモ - 3 - (6 - オキサ - 3 - アザビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキス - 3 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
(±) - 5 - ブロモ - 3 - { [2 - (フェノキシメチル) モルホリノ - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
(S) - 5 - ブロモ - 3 - { [2 - (フェノキシメチル) モルホリノ - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
(R) - 5 - ブロモ - 3 - { [2 - (フェノキシメチル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
6 - ヒドロキシ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - (2 - フリル) - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 5 - (フェニルエチニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 5 - (2 - フェニルエチル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - ヘキス - 1 - インイル - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - ヘキシル - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
2 - (アミノカルボニル) - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 5 - カルボン酸メチル ;
3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 5 - ビニル - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - ヒドロキシ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - エトキシ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 5 - プロポキシ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - イソプロポキシ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - エチル - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
メタンスルホン酸 2 - (アミノカルボニル) - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 5 - イル ;
3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 5 - プロピ - 1 - インイル - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 5 - チエン - 2 - イル - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
3 - (アゼチジン - 1 - イルスルホニル) - 5 - メトキシ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - ホルミル - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - メチル - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
7 - (アセチルアミノ) - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

7 - [(メチルスルホニル) アミノ] - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1
H - インドール - 2 - カルボキサミド;
5 - { [(4 - メトキシフェニル) アミノ] メチル} - 3 - モルホリノ - 4 - イルスル
ホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド;
5 - { [(2 - アセトアミド) アミノ] メチル} - 3 - モルホリノ - 4 - イルスルホニ
ル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド;
3 - (モルホリノ - 4 - イルスルホニル) - 5 - フェニル - 1 H - インドール - 2 - カ
ルボキサミド;
3 - (モルホリノ - 4 - イルスルホニル) - 5 - ピラジン - 2 - イル - 1 H - インド
ール - 2 - カルボキサミド;
3 - (モルホリノ - 4 - イルスルホニル) - 5 - ピリジン - 2 - イル - 1 H - インド
ール - 2 - カルボキサミド;
3 - (モルホリノ - 4 - イルスルホニル) - 5 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - インド
ール - 2 - カルボキサミド;
5 - (1 - ベンゾフラン - 2 - イル) - 3 - (モルホリノ - 4 - イルスルホニル) - 1
H - インドール - 2 - カルボキサミド;
5 - (5 - メチル - 2 - フリル) - 3 - (モルホリノ - 4 - イルスルホニル) - 1 H -
インドール - 2 - カルボキサミド;
5 - (3, 5 - ジメチルイソオキサゾール - 4 - イル) - 3 - (モルホリノ - 4 - イル
スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド;
3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 5 - (1 H - ピロール - 2 - イル) - 1 H
- インドール - 2 - カルボキサミド;
3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 5 - ピリジン - 3 - イル - 1 H - インド
ール - 2 - カルボキサミド;
3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 5 - (1, 3 - チアゾール - 2 - イル) -
1 H - インドール - 2 - カルボキサミド;
3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 5 - チエン - 3 - イル - 1 H - インドール
- 2 - カルボキサミド;
5 - (1 - ベンゾチエン - 3 - イル) - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1
H - インドール - 2 - カルボキサミド;
3 - (アゼチジン - 1 - イル) スルホニル) - 5 - ヨード - 1 H - インドール - 2 - カ
ルボキサミド;
3 - [(3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル) スルホニル] - 5 - ヨード - 1 H - イ
ンドール - 2 - カルボキサミド;
(±) - 5 - ヨード - 3 - { [2 - (フェノキシメチル) モルホリノ - 4 - イル] スル
ホニル} - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド;
(S) - 5 - ヨード - 3 - { [2 - (フェノキシメチル) モルホリノ - 4 - イル] スル
ホニル} - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド;
(R) - 5 - ヨード - 3 - { [2 - (フェノキシメチル) モルホリン - 4 - イル] スル
ホニル} - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド;
7 - アミノ - 6 - ブロモ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インド
ール - 2 - カルボキサミド;
7 - アミノ - 4, 6 - ジブロモ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - イ
ンドール - 2 - カルボキサミド;
6 - ブロモ - 7 - (ジメチルアミノ) - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1
H - インドール - 2 - カルボキサミド;
3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 7 - [(ピリジン - 4 - イルメチル) アミ
ノ] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド;
7 - { [(2 - クロロピリジン - 4 - イル) メチル] アミノ} - 3 - (モルホリン - 4
- イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド;

7 - ニトロ - 3 - { [(2 S) - 2 - (フエノキシメチル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
7 - アミノ - 3 - { [(2 S) - 2 - (フエノキシメチル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
3 - { [(2 S) - 2 - (フエノキシメチル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 7 - [(ピリジン - 4 - イルメチル) アミノ] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
7 - (ベンジルアミノ) - 3 - { [(2 S) - 2 - (フエノキシメチル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
7 - クロロ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
6 - プロモ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
7 - プロモ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
7 - シアノ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
(±) - 7 - (メチルスルフィニル) - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
7 - アミノメチル - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - アミノ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
(S) - 5 - フルオロ - 3 - { [2 - (フエノキシメチル) モルホリノ - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
(R) - 5 - フルオロ - 3 - { [2 - (フエノキシメチル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - アセチルアミノ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - [(メチルスルホニル) アミノ] - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 5 - [(トリフルオロアセチル) アミノ] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - [(2 - アミノエチル) アミノ] - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - (ジメチルアミノ) - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
4 , 5 - ジブロモ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 , 6 - ジブロモ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - ブロモ - 4 - ニトロ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - ブロモ - 6 - ニトロ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - ブロモ - 6 - アミノ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
5 - ブロモ - 4 - アミノ - 3 - (モルホリン - 4 - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
(S) - 3 - { [2 - (フエノキシメチル) モルホリノ - 4 - イル] スルホニル } - 1

H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - プロモ - 3 - ({ 2 - [(シクロヘキシルアミノ) カルボニル] モルホリン - 4 -
 イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - プロモ - 3 - ({ 2 - [(2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イルアミノ)
 カルボニル] モルホリン - 4 - イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサ
 ミド ;
 5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(2 - フェニルエチル) アミノ] カルボニル } モルホリ
 ン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(3 - フェニルプロピル) アミノ] カルボニル } モルホ
 リン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(3 , 3 - ジフェニルプロピル) アミノ] カルボニル }
 モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - プロモ - 3 - { [2 - (3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 2 (1 H) - イルカルボ
 ニル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(2 - フェノキシエチル) アミノ] カルボニル } モルホ
 リン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 3 - ({ 2 - [(3 - ベンジルピロリジン - 1 - イル) カルボニル] モルホリン - 4 -
 イル } スルホニル) - 5 - プロモ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 2 - イル
 メチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール
 - 2 - カルボキサミド ;
 3 - ({ 2 - [(ベンジルアミノ) カルボニル] モルホリン - 4 - イル } スルホニル)
 - 5 - プロモ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - プロモ - 3 - { [2 - ({ [3 - (トリフルオロメチル) ベンジル] アミノ } カルボ
 ニル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(2 , 2 - ジフェニルエチル) アミノ] カルボニル } モ
 ルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - プロモ - 3 - ({ 2 - [(2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 2 - イルアミノ)
 カルボニル] モルホリン - 4 - イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサ
 ミド ;
 7 - { [2 - (アミノカルボニル) - 5 - プロモ - 1 H - インドール - 3 - イル] スル
 ホニル } - 2 - ベンジル - 7 - アザ - 2 - アゾニアスピロ [4 . 4] ノナン ;
 5 - プロモ - 3 - { [2 - ({ [(5 - メチルピラジン - 2 - イル) メチル] アミノ {
 カルボニル } モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサ
 ミド ;
 3 - ({ [(4 - { [2 - (アミノカルボニル) - 5 - プロモ - 1 H - インドール - 3
 - イル] スルホニル } モルホリン - 2 - イル) カルボニル] アミノ } メチル) ピリジン ;
 5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(1 - フェニルエチル) アミノ] カルボニル } モルホリ
 ン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 1 - (3 - { [(4 - { [2 - (アミノカルボニル) - 5 - プロモ - 1 H - インドール
 - 3 - イル] スルホニル } モルホリン - 2 - イル) カルボニル] アミノ } プロピル) - 1
 H - イミダゾール ;
 5 - プロモ - 3 - { [2 - ({ [(1 R) - 1 - フェニルエチル] アミノ } カルボニル)
 モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(2 - フェニルプロピル) アミノ] カルボニル } モルホ
 リン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 3 - [(2 - { [ベンジル (メチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル)
 スルホニル] - 5 - プロモ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 1 - [(4 - { [2 - (アミノカルボニル) - 5 - プロモ - 1 H - インドール - 3 - イ
 ル] スルホニル } モルホリン - 2 - イル) カルボニル] - 4 - ベンジルピラジン ;

2 - ({ [(4 - { [2 - (アミノカルボニル) - 5 - プロモ - 1 H - インドール - 3 - イル] スルホニル } モルホリン - 2 - イル) カルボニル] アミノ } メチル) ピリジン ;
 5 - プロモ - 3 - { [2 - ({ [2 - (t e r t - ブチルチオ) エチル] アミノ } カルボニル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

3 - ({ 2 - [(ベンズヒドリルアミノ) カルボニル] モルホリン - 4 - イル } スルホニル) - 5 - プロモ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - { [2 - ({ [(2 S) - 2 - フェニルシクロプロピル] アミノ } カルボニル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - ({ 2 - [(3 - フェニルピロリジン - 1 - イル) カルボニル] モルホリン - 4 - イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - ({ 2 - [(4 , 4 - ジフェニルピペリジン - 1 - イル) カルボニル] モルホリン - 4 - イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 2 - イルメチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - ({ 2 - [(2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イルアミノ) カルボニル] モルホリン - 4 - イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - ({ 2 - [(2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イルアミノ) カルボニル] モルホリン - 4 - イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - ({ 2 - [(3 - ピリジン - 4 - イルピロリジン - 1 - イル) カルボニル] モルホリン - 4 - イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(2 - ヒドロキシ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 1 - イル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - ({ 2 - [(4 - ヒドロキシ - 4 - フェニルピペリジン - 1 - イル) カルボニル] モルホリン - 4 - イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

3 - { [2 - (アニリノカルボニル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 5 - プロモ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(2 - オキソ - 2 - フェニルエチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - ({ 2 - [(ネオペンチルアミノ) カルボニル] モルホリン - 4 - イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(1 , 2 - ジフェニルエチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(4 - クロロフェニル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(4 - フェノキシフェニル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(4 - t e r t - ブチルフェニル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - { [2 - ({ [3 - (2 - オキソピロリジン - 1 - イル) プロピル] アミノ] カルボニル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(3 - イソプロポキシプロピル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(3 - エトキシプロピル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(2 - シクロヘキス - 1 - エン - 1 - イルエチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(2 , 2 , 3 , 3 , 4 , 4 , 4 - ヘプタフルオロブチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(3 - イソブトキシプロピル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(3 - ブトキシプロピル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(2 - チエン - 2 - イルエチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

2 - ({ [(4 - { [2 - (アミノカルボニル) - 5 - プロモ - 1H - インドール - 3 - イル] スルホニル } モルホリン - 2 - イル) カルボニル] アミノ } メチル) - 1H - ベンズイミダゾール ;

3 - { [2 - (アゼパン - 1 - イルカルボニル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 5 - プロモ - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - ({ 2 - [({ 2 - [(2 , 6 - ジクロロベンジル) チオ] エチル } アミノ) カルボニル] モルホリン - 4 - イル } スルホニル) - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

3 - { [2 - ({ [4 - (アミノスルホニル) ベンジル] アミノ } カルボニル } モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 5 - プロモ - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - { [2 - (チオモルホリン - 4 - イルカルボニル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(2 - メトキシエチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(2 - メトキシ - 1 - メチルエチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(1 - エチルプロピル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - { [2 - ({ [6 - (ジメチルアミノ) ヘキシル] アミノ } カルボニル } モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(テトラヒドロフラン - 2 - イルメチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(1 - フェニルシクロプロピル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - { [2 - ({ [フェニル (ピリジン - 4 - イル) メチル] アミノ } カルボニル } モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(ジシクロプロピルメチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(1 , 4 - ジオキサン - 2 - イルメチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - { [2 - ({ メチル [2 - (4 - メチルフェノキシ) エチル] アミノ } カルボニル } モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - { [2 - ({ [(1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチエン - 3 - イル) メチル] アミノ } カルボニル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [2 - (2 - フェニルエチル) ピロリジン - 1 - イル] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(2 - シクロヘキシルエチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

4 - ({ [(4 - { [2 - (アミノカルボニル) - 5 - プロモ - 1 H - インドール - 3 - イル] スルホニル } モルホリン - 2 - イル) カルボニル] アミノ } メチル) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(1 , 1 - ジオキシドテトラヒドロチエン - 3 - イル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(1 - ナフチルメチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - プロモ - 3 - [(2 - { [(イミダゾ [2 , 1 - b] [1 , 3] チアゾール - 6 - イルメチル) アミノ] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

3 - [(2 - { [2 - (1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル) ピロリジン - 1 - イル] カルボニル } モルホリン - 4 - イル) スルホニル] - 5 - プロモ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - クロロ - 3 - ({ 2 - [(2 - エトキシフェノキシ) メチル] モルホリン - 4 - イル } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - クロロ - 3 - [(1 R , 4 R) - 2 - オキサ - 5 - アザビシクロ [2 . 2 . 1] ヘプト - 5 - イルスルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

7 - { [(2 - (アミノカルボニル) - 5 - クロロ - 1 H - インドール - 3 - イル] スルホニル } - 3 - ベンジル - 9 - チア - 7 - アザ - 3 - アゾニアビシクロ [3 . 3 . 1] ノナン ;

5 - クロロ - 3 - { [2 - (1 H - インドール - 4 - イル) モルホリン - 4 - イル] スルホニル] - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - クロロ - 3 - (2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾオキサアゼピン - 4 (5 H) - イルスルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

3 - [(ベンゾフラン - イル - 1 - オキサ - 8 - アザスピロ [4 . 5] デク - 8 - イル) スルホニル] - 5 - クロロ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - クロロ - 3 - { [4 - フルオロ - 4 - (3 - フェニルプロピル) ピペリジン - 1 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

3 - [(3 - ベンジル - 1 - オキサ - 8 - アザスピロ [4 . 5] デク - 8 - イル) スルホニル] - 5 - クロロ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

3 - ({ 4 - [(ベンジルオキシ) メチル] - 4 - フェニルピペリジン - 1 - イル } スルホニル) - 5 - クロロ - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

5 - クロロ - 3 - { [4 - ヒドロキシ - 4 - (3 - フェニルプロピル) ピペリジン - 1 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;

7 - { [2 - (アミノカルボニル) - 5 - クロロ - 1 H - インドール - 3 - イル] スルホニル } - 2 - (4 - クロロフェニル) - 7 - アザ - 2 - アゾニアスピロ [4 . 4] ノナン ;

3 - (1 - { [2 - (アミノカルボニル) - 5 - クロロ - 1 H - インドール - 3 - イル] スルホニル } ピペリジン - 3 - イル) - 4 - メチル - 4 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール ;

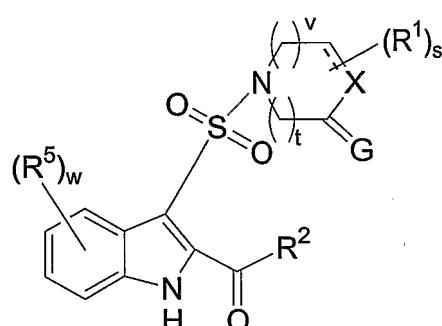
5 - クロロ - 3 - { [3 - (2 - フェニルエチル) ピペリジン - 1 - イル] スルホニル

} - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - クロロ - 3 - { [3 - (2 - フェニルエチル) ピロリジン - 1 - イル] スルホニル
 } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - クロロ - 3 - { [4 - (シクロプロピル { [3 - (トリフルオロメチル) フェニル
] スルホニル } アミノ) ピペリジン - 1 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 -
 カルボキサミド ;
 5 - クロロ - 3 - ({ 2 - [(4 - クロロフェノキシ) メチル] モルホリン - 4 - イル
 } スルホニル) - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 (1 - { [2 - (アミノカルボニル) - 5 - クロロ - 1 H - インドール - 3 - イル] ス
 ルホニル } ピペリジン - 3 - イル) 酢酸 *t e r t* - ブチル ;
 3 - [(3 - ベンジルピペリジン - 1 - イル) スルホニル] - 5 - クロロ - 1 H - イン
 ドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - クロロ - 3 - { [3 - (2 - メチルフェニル) ピペリジン - 1 - イル] スルホニル
 } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 2 - (1 - { [2 - (アミノカルボニル) - 5 - クロロ - 1 H - インドール - 3 - イル
] スルホニル } ピペリジン - 4 - イル) - N , N - ジメチルエタンアミン ;
 1 - (1 - { [2 - (アミノカルボニル) - 5 - クロロ - 1 H - インドール - 3 - イル
] スルホニル } ピペリジン - 4 - イル) - 3 - (エトキシカルボニル) ピペリジン ;
 5 - ブロモ - 3 - { [3 - (4 - *t e r t* - ブトキシベンジル) ピペリジン - 1 - イル
] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - ブロモ - 3 - { [4 - (3 - フェニルプロピル) ピペリジン - 1 - イル] スルホニ
 ル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 5 - ブロモ - N - メトキシ - N - メチル - 3 - { [2 - (フェノキシメチル) モルホリ
 ン - 4 - イル] スルホニル } - 1 H - インドール - 2 - カルボキサミド ;
 は除く。

【請求項 2】

下記式 II で表される請求項 1 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは立体異性体。

【化 153】



II

[式中、

- - - - - は、存在しても良い二重結合を表し；

X は C 、 N 、 S (O)_m または O であり；

G は H₂ または O であり；

R^a は独立に、

1) H 、

2) C₁ ~ C₆ アルキル、

3) ハロゲン、

4) アリール、

5) 複素環、

6) $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、および

7) OR^4

から選択され；

前記アルキル、アリール、複素環およびシクロアルキルは、 R^7 から選択される少なくとも 1 個の置換基で場合によっては置換されていても良く；

R^1 は独立に、

1) H、

2) $(CR^a_2)_n R^6$ 、

3) $(CR^a_2)_n C(O)R^4$ 、

4) $C(O)N(R^4)_2$ 、

5) $(CR^a_2)_n OR^4$ 、

6) $(CR^a_2)_n N(R^4)_2$ 、

7) $S(O)_m R^6$ 、

8) $S(O)_m R^6 OR^4$ 、

9) $C(O)N(R^4)(CR^a_2)_n R^6$ 、

10) $C(O)N(R^4)(CR^a_2)_n OR^4$ 、

11) $C(O)R^6(CR^a_2)_n R^6$ 、

12) $C(O)N(R^4)(CR^a_2)_n S(O)_m (CR^a_2)_n R^6$ 、

13) $C(O)N(R^4)(CR^a_2)_n C(O)R^6$ 、

14) $C(O)N(R^4)(CR^a_2)_n N(R^4)_2$ 、

15) ハロゲン、

16) $N(R^4)S(O)_m R^6$ および

17) $(CR^a_2)_n C(O)OR^4$

から選択され；

R^2 は、

1) H、

2) 未置換もしくは置換 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル、

3) $N(R^4)_2$ 、または

4) OR^4

であり；

R^4 は独立に、

1) H、

2) $C_1 \sim C_6$ アルキル、

3) $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル、

4) アリール、

5) 複素環、

6) CF_3 、

7) $C_2 \sim C_6$ アルケニル、および

8) $C_2 \sim C_6$ アルキニル

から選択され；

前記アルキル、シクロアルキル、アリール、複素環、アルケニルおよびアルキニルは、 R^7 から選択される少なくとも 1 個の置換基で場合によっては置換されていても良く；

R^5 は独立に、

1) H、

2) ハロゲン、

3) NO_2 、

4) CN 、

5) $CR^4 = C(R^4)_2$ 、

6) C_2CR^4 、

7) $(CR^a_2)_n OR^4$ 、

8) (C R ^a ₂) _n N (R ⁴) ₂、
 9) C (O) R ⁴、
 10) C (O) O R ⁴、
 11) (C R ^a ₂) _n R ⁴、
 12) S (O) _m R ⁶、
 13) S (O) _m N (R ⁴) ₂、
 14) O S (O) _m R ⁶、
 15) N (R ⁴) C (O) R ⁴、
 16) N (R ⁴) S (O) _m R ⁶、
 17) (C R ^a ₂) _n N (R ⁴) R ⁶、
 18) (C R ^a ₂) _n N (R ⁴) R ⁶ O R ⁴、
 19) (C R ^a ₂) _n N (R ⁴) (C R ^a ₂) _n C (O) N (R ⁴) ₂、
 20) N (R ⁴) (C R ^a ₂) _n R ⁶、
 21) N (R ⁴) (C R ^a ₂) _n N (R ⁴) ₂、 および
 22) (C R ^a ₂) _n C (O) N (R ⁴) ₂

から選択され；

R ⁶ は独立に、

- 1) C ₁ ~ C ₆ アルキル、
- 2) アリール、
- 3) 複素環、 および
- 4) C ₃ ~ C ₁₀ シクロアルキル

から選択され；

前記アルキル、アリール、複素環およびシクロアルキルは、少なくとも1個の R ⁷ 置換基で場合によっては置換されていても良く；

R ⁷ は独立に、

- 1) 未置換もしくは置換 C ₁ ~ C ₆ アルキル、
- 2) ハロゲン、
- 3) O R ⁴、
- 4) C F ₃、
- 5) 未置換もしくは置換アリール、
- 6) 未置換もしくは置換 C ₃ ~ C ₁₀ シクロアルキル、
- 7) 未置換もしくは置換複素環、

- 8) S (O) _m N (R ⁴) ₂、
- 9) C (O) O R ⁴、
- 10) C (O) R ⁴、
- 11) C N、
- 12) C (O) N (R ⁴) ₂、
- 13) N (R ⁴) C (O) R ⁴、
- 14) S (O) _m R ⁶、 および
- 15) N O ₂

から選択され；

mは独立に、0、1または2であり；

nは独立に0、1、2、3、4、5または6であり；

sは0 ~ 6であり；

tは0、1または2であり；

vは0、1または2であり；

wは0、1、2、3または4である。】

【請求項3】

R ^a が独立に、

- 1) H、

2) $C_1 \sim C_6$ アルキル、

3) アリール、および

4) $C_3 \sim C_{10}$ シクロアルキル

から選択され；

前記アルキル、アリールおよびシクロアルキルが、 R^7 から選択される少なくとも 1 個の置換基で場合によっては置換されていても良く；

R^1 が独立に、

1) H、

2) $(CR^a_2)_n R^6$ 、

3) $(CR^a_2)_n C(O)R^4$ 、

4) $C(O)N(R^4)_2$ 、

5) $(CR^a_2)_n OR^4$ 、

6) $(CR^a_2)_n N(R^4)_2$ 、

7) $S(O)_m R^6$ 、

8) $S(O)_m R^6 OR^4$ 、

9) $C(O)N(R^4)(CR^a_2)_n R^6$ 、

10) $C(O)N(R^4)(CR^a_2)_n OR^4$ 、

11) $N(R^4)S(O)_m R^6$ および

12) $(CR^a_2)_n C(O)OR^4$

から選択され；

R^2 が、

1) $N(R^4)_2$ 、または

2) OR^4

であり；

s が 0 ~ 3 である請求項 2 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは立体異性体。

【請求項 4】

R^1 が独立に、

1) H、

2) $(CR^a_2)_n R^6$ 、

3) $(CR^a_2)_n C(O)R^4$ 、

4) $C(O)N(R^4)_2$ 、

5) $(CR^a_2)_n OR^4$ 、

6) $(CR^a_2)_n N(R^4)_2$ 、

7) $S(O)_m R^6$ 、および

8) $S(O)_m R^6 OR^4$

から選択される請求項 3 に記載の化合物または該化合物の製薬上許容される塩もしくは立体異性体。