

【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29年10月12日(2017.10.12)

【公開番号】特開2017-149769(P2017-149769A)

【公開日】平成29年8月31日(2017.8.31)

【年通号数】公開・登録公報2017-033

【出願番号】特願2017-96307(P2017-96307)

【国際特許分類】

C 0 7 D	487/04	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/04	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/14	(2006.01)
A 6 1 P	31/18	(2006.01)
A 6 1 P	31/16	(2006.01)
A 6 1 P	31/20	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 K	31/4188	(2006.01)
A 6 1 K	31/454	(2006.01)
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
A 6 1 K	31/427	(2006.01)
A 6 1 K	31/4545	(2006.01)
A 6 1 K	31/675	(2006.01)
C 0 7 F	9/6561	(2006.01)
C 1 2 N	9/99	(2006.01)
C 1 2 N	15/09	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D	487/04	1 3 8
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	37/04	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	31/00	
A 6 1 P	31/14	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	31/16	
A 6 1 P	31/20	
A 6 1 P	31/12	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 K	31/4188	
A 6 1 K	31/454	
A 6 1 K	31/4439	
A 6 1 K	31/506	
A 6 1 K	31/427	
A 6 1 K	31/4545	
A 6 1 P	43/00	1 2 3
A 6 1 K	31/675	

C 0 7 F 9/6561 C S P  
 C 1 2 N 9/99 Z N A  
 C 1 2 N 15/00 A

## 【手続補正書】

【提出日】平成29年8月4日(2017.8.4)

## 【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】

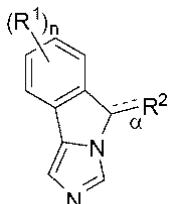
【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

医薬組成物であって、該医薬組成物は、約0.1mg～約500mgの式(I)の化合物、または体重1kg当たり約0.01mg～約100mgの式(I)の化合物の用量に相当する量を含み、

式(I)の化合物が、構造

## 【化114】



を有するか、またはその医薬上許容される塩であり、

該式において、

結合は単結合または二重結合であり、

nは0、1、2、3、または4であり；

$R^1$ はそれぞれ独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、-OR、-N(R)<sub>2</sub>、-SR、-C(O)OR、-C(O)N(R)<sub>2</sub>、-C(O)R、-S(O)R、-S(O)OR、-S(O)N(R)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R、-S(O)<sub>2</sub>OR、-S(O)<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>、-OC(O)R、-OC(O)OR、-OC(O)N(R)<sub>2</sub>、-N(R)C(O)R、-N(R)C(O)OR、または-N(R)C(O)N(R)<sub>2</sub>であり、

結合が単結合の場合、 $R^2$ は-C<sub>1-4</sub>アルキル-R<sup>A</sup>または-C<sub>2-4</sub>アルケニル-R<sup>3</sup>であり、そして、

結合が二重結合の場合、 $R^2$ は=C(H)R<sup>A</sup>であり、

ここでは、

$R^A$ は-CN、-C(O)R<sup>3</sup>、-C(O)OR<sup>3</sup>、-C(O)N(R<sup>3</sup>)(R<sup>C</sup>)、-C(OR<sup>B</sup>)(R<sup>3</sup>)(R<sup>C</sup>)、-C(NHR<sup>B</sup>)(R<sup>3</sup>)(R<sup>C</sup>)、または-C(=N-OR<sup>C</sup>)R<sup>3</sup>であり、

ここでは、

$R^B$ は水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、-C<sub>1-6</sub>アルキル-R<sup>B1</sup>、-C(O)R<sup>3</sup>、-C(O)N(H)R<sup>3</sup>、または-S(O)<sub>2</sub>R<sup>3</sup>、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>COOR、-C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>(NR)COOR、-C(O)CH(NH<sub>2</sub>)(R<sup>D</sup>)、-S(O)<sub>2</sub>OR<sup>3</sup>、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>-OP(O)<sub>2</sub>(OR)<sub>2</sub>、または-P(O)(OR<sup>3</sup>)<sub>2</sub>であり、

ここでは、

$R^{B1}$ はシアノ、ニトロ、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ ハロアルキル、-OR、-N(R)<sub>2</sub>、-SR、-C(O)OR、-C(O)N(R)<sub>2</sub>、-C(O)R、-S(O)R、-S(O)OR、-S(O)N(R)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R、-S(O)<sub>2</sub>OR、-S(O)<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>、-OC(O)R、-OC(O)OR、-OC(O)N(R)<sub>2</sub>、-N(R)C(O)R、-N(R)C(O)OR、または-N(R)C(O)N(R)<sub>2</sub>であり；

$R^D$ は水素、メチル、-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CH(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>)、ベンジル、4-ヒドロキシベンジル、-CH<sub>2</sub>(3-インドリル)、-CH<sub>2</sub>SH、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>OH、-CH(CH<sub>3</sub>)OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-NH<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-N(H)C(=NH)NH<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>(4-イミダゾリル)、-CH<sub>2</sub>COOH、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>COOH、

-CH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>であり；

R<sup>3</sup>はそれぞれ独立して水素、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルケニル、3-10員環ヘテロシクリル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル-、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル-、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキル-、C<sub>3-8</sub>シクロアルケニルC<sub>1-6</sub>アルキル-、(3-10員環ヘテロシクリル)C<sub>1-6</sub>アルキル-、または(ヘテロアリール)-(3-10員環ヘテロシクリル)-であり、

ここでは、

該アルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルケニル、3-10員環ヘテロシクリル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキル-、C<sub>3-8</sub>シクロアルケニルC<sub>1-6</sub>アルキル-、(3-10員環ヘテロシクリル)C<sub>1-6</sub>アルキル-、および(ヘテロアリール)-(3-10員環ヘテロシクリル)-は、それぞれ任意に独立して1つの=R<sup>32</sup>基と置換され、それぞれ任意に独立して1つ、2つ、3つまたは4つのR<sup>31</sup>基と置換され、

該アリール、ヘテロアリール、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル-、およびヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル-基はそれぞれ任意に1つ、2つ、3つまたは4つのR<sup>31</sup>基と置換され、

ここでは

R<sup>31</sup>はそれぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1-6</sub>アルキル、-C<sub>1-6</sub>アルキル-R<sup>33</sup>、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、-OR、-N(R)<sub>2</sub>、-SR、-C(O)OR、-C(O)N(R)<sub>2</sub>、-C(O)N(OH)R、-C(O)R、-C(NR<sup>11</sup>)R、-C(NR<sup>11</sup>)N(R<sup>11</sup>)R、-S(O)R、-S(O)OR、-S(O)N(R)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R、-S(O)<sub>2</sub>OR、-S(O)<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>、-OC(O)R、-OC(O)OR、-OC(O)N(R)<sub>2</sub>、-N(R)C(O)R、-N(R)C(O)OR、-N(R)C(O)N(R)<sub>2</sub>であり、

ここでは

R<sup>33</sup>はシアノ、-OR、-N(R)<sub>2</sub>、-SR、-C(O)OR、-C(O)N(R)<sub>2</sub>、-C(O)R、-S(O)R、-S(O)OR、-S(O)N(R)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R、-S(O)<sub>2</sub>OR、-S(O)<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>、-OC(O)R、-OC(O)OR、-OC(O)N(R)<sub>2</sub>、-N(R)C(O)R、-N(R)C(O)OR、または-N(R)C(O)N(R)<sub>2</sub>であり、

R<sup>32</sup>は=O、=S、=N(R)、=N(OR)、=C(R<sup>34</sup>)<sub>2</sub>、=(スピロ-C<sub>3-8</sub>シクロアルキル)、または=(スピロ-(3-10員環ヘテロシクリル))であり、ここでは

R<sup>34</sup>はそれぞれ独立して水素、ハロゲン、シアノ、C<sub>1-6</sub>アルキル、-C<sub>1-6</sub>アルキル-OR、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、または3-10員環ヘテロシクリルであり、

または2つのR<sup>34</sup>は、それらが共に結合する原子と一緒に、单環C<sub>3-8</sub>シクロアルキルまたは单環3-8員環ヘテロシクリルを形成し、

R<sup>C</sup>は水素またはC<sub>1-6</sub>アルキルであり、

Rはそれぞれ独立して水素またはR<sup>10</sup>であり、ここでは

R<sup>10</sup>はC<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルケニル、3-10員環ヘテロシクリル、アリールC<sub>1-6</sub>アルキル、ヘテロアリールC<sub>1-6</sub>アルキル-、C<sub>3-8</sub>シクロアルキルC<sub>1-6</sub>アルキル-、C<sub>3-8</sub>シクロアルケニルC<sub>1-6</sub>アルキル-、または(3-10員環ヘテロシクリル)C<sub>1-6</sub>アルキル-であり、R<sup>10</sup>はそれぞれ任意に1つ、2つ、3つまたは4つの以下の基と置換され、それらの基はそれぞれ独立してハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、-OR<sup>11</sup>、-N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>、-SR<sup>11</sup>、-C(O)OR<sup>11</sup>、-C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>、-C(O)R<sup>11</sup>、-S(O)R<sup>11</sup>、-S(O)OR<sup>11</sup>、-S(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>、-S(O)<sub>2</sub>OR<sup>11</sup>、-S(O)<sub>2</sub>N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>、-OC(O)R<sup>11</sup>、-OC(O)OR<sup>11</sup>、-OC(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>11</sup>)C(O)R<sup>11</sup>、-N(R<sup>11</sup>)C(O)OR<sup>11</sup>、-N(R<sup>11</sup>)C(O)N(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>11</sup>)S(O)<sub>2</sub>R<sup>11</sup>、または-C(O)-(3-10員環ヘテロシクリル)であり、ここではR<sup>11</sup>はそれぞれ独立して水素またはC<sub>1-6</sub>アルキルであり、

該医薬組成物が、医薬上許容される希釈剤、賦形剤または担体を含む、医薬組成物。

### 【請求項2】

結合は単結合である、請求項1に記載の組成物。

### 【請求項3】

R<sup>2</sup>は-C<sub>1-4</sub>アルキル-R<sup>A</sup>である、請求項1または2に記載の組成物。

### 【請求項4】

R<sup>A</sup>は-C(O)R<sup>3</sup>または-C(OR<sup>B</sup>)(R<sup>3</sup>)(R<sup>C</sup>)である、請求項1~3のいずれかに記載の組成物。

**【請求項 5】**

$R^A$ は $-C(O)R^3$ である、請求項1～4のいずれかに記載の組成物。

**【請求項 6】**

$R^3$ はアリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルケニル、3-10員環ヘテロシクリルまたは $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキル-であり、

ここでは、該 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルケニル、3-10員環ヘテロシクリルおよび $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキル-はそれぞれ任意に独立して1つの $=R^{32}$ 基と置換され、それぞれ任意に独立して1つまたは2つの $R^{31}$ 基と置換され、

該アリール基および該ヘテロアリール基はそれぞれ任意に1つまたは2つの $R^{31}$ 基と置換される、

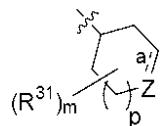
請求項1～5のいずれかに記載の組成物。

**【請求項 7】**

$R^3$ はフェニル、または、5または6員環ヘテロアリールであり、それぞれ任意に1つまたは2つの $R^{31}$ 基と置換される、請求項1～5のいずれかに記載の組成物。

**【請求項 8】**

$R^3$ は

**【化115】**

であり、ここでは、

結合aは単結合または二重結合であり、

mは0、1、または2であり、

pは0または1であり

結合aが単結合の場合、Zは $-C(R^{36})_2$ 、 $-C(=R^{32})$ 、 $-N(R^{35})$ 、または $-O-$ であり、ここでは

$R^{35}$ は水素、 $C_{1-6}$ アルキル、 $-C(O)R$ 、 $-S(O)_2R$ 、 $-C(O)OR$ 、 $-C(O)N(R)_2$ 、 $-S(O)_2OR$ 、または $-S(O)_2N(R)_2$ であり、

結合aが二重結合の場合、Zは $-C(R^{36})=$ または $-N=$ であり、

$R^{36}$ はそれぞれ独立して水素または $R^{31}$ である、

請求項1～5のいずれかに記載の組成物。

**【請求項 9】**

結合aが単結合であり、Zは $-C(R^{36})_2$ または $-C(=R^{32})$ である、請求項8に記載の組成物。

**【請求項 10】**

結合aが単結合であり、Zは $-N(R^{35})$ または $-O-$ である、請求項8に記載の組成物。

**【請求項 11】**

nは0または1であり、

$R^1$ はそれぞれ独立してハロゲン、 $-OR$ 、 $-N(R)_2$ 、または $-SR$ であり、

$R^2$ は $-CH_2-R^A$ 、 $-CH_2CH_2-R^A$ 、または $-C(H)=C(H)R^3$ であり、

ここでは

$R^A$ は $-C(O)R^3$ 、または $-C(OR^B)(R^3)(R^C)$ であり、ここでは

$R^B$ は水素であり、

$R^3$ はそれぞれ独立して水素、 $C_{1-6}$ アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルケニル、3-10員環ヘテロシクリルまたは $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキル-であり、

ここでは、

該 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、 $C_{3-8}$ シクロアルケニル、3-10員環ヘテロシクリルおよび $C_{3-8}$ シクロアルキル $C_{1-6}$ アルキル-はそれぞれ任意に独立して1つの $=R^{32}$ 基と置換され、それぞれ任意に独立して1つまたは2つの $R^{31}$ 基と置換され、

該アリール基および該ヘテロアリール基はそれぞれ任意に1つまたは2つのR<sup>31</sup>基と置換され、

ここでは、

R<sup>31</sup>は独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1-6</sub>アルキル、-C<sub>1-6</sub>アルキル-R<sup>33</sup>、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、-OR、-N(R)<sub>2</sub>、-SR、-C(O)OR、-C(O)N(R)<sub>2</sub>、-C(O)R、-S(O)R、-S(O)OR、-S(O)N(R)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R、-S(O)<sub>2</sub>OR、-S(O)<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>、-OC(O)R、-OC(O)OR、-OC(O)N(R)<sub>2</sub>、-N(R)C(O)R、-N(R)C(O)OR、-N(R)C(O)N(R)<sub>2</sub>であり、ここでは、R<sup>33</sup>は-OR、-N(R)<sub>2</sub>、または-SRであり、

R<sup>32</sup>はオキソ、=C(R<sup>34</sup>)<sub>2</sub>、=(スピロ-C<sub>3-8</sub>シクロアルキル)、または=(スピロ-(3-10員環ヘテロシクリル))であり、ここでは、

R<sup>34</sup>はそれぞれ独立して水素、ハロゲン、C<sub>1-6</sub>アルキル、またはC<sub>3-8</sub>シクロアルキルであり、

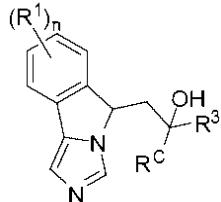
R<sup>C</sup>は水素またはC<sub>1-6</sub>アルキルである、

請求項2に記載の組成物。

【請求項12】

前記化合物が、式

【化116】



の化合物またはその医薬上許容される塩である、請求項11に記載の組成物。

【請求項13】

R<sup>3</sup>はアリール、ヘテロアリール、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルケニル、または3-10員環ヘテロシクリルであり、ここでは、

該C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、C<sub>3-8</sub>シクロアルケニル、および3-10員環ヘテロシクリルはそれぞれ任意に1つの=R<sup>32</sup>基および、1、2、3または4つのR<sup>31</sup>基と置換され、

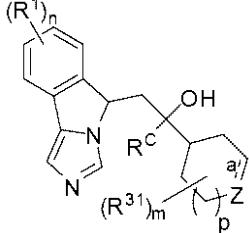
該アリールおよび該ヘテロアリールはそれぞれ任意に1、2、3または4つのR<sup>31</sup>基と置換される、

請求項12に記載の組成物。

【請求項14】

前記化合物が、式

【化117】



の化合物またはその医薬上許容される塩であり、

ここでは、

結合aは単結合または二重結合であり、

mは0、1、または2であり、

pは0または1であり、

結合aが単結合の場合、Zは-C(R<sup>36</sup>)<sub>2</sub>-、-C(=R<sup>32</sup>)-、-N(R<sup>35</sup>)-、または-O-であり、ここでは、R<sup>35</sup>は水素、C<sub>1-6</sub>アルキル、-C(O)R、-S(O)<sub>2</sub>R、-C(O)OR、-C(O)N(R)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>OR、または-S(O)<sub>2</sub>N(R)<sub>2</sub>であり、

結合aが二重結合の場合、Zは-C(R<sup>3,6</sup>)=または-N=であり、

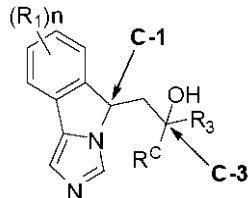
R<sup>3,6</sup>はそれぞれ独立して水素またはR<sup>3,1</sup>である、

請求項13に記載の組成物。

**【請求項15】**

前記化合物が、式

**【化118】**



の化合物またはその医薬上許容される塩であり、

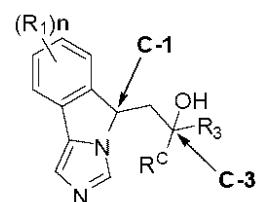
ここでは、炭素-1(C-1)および炭素-3(C-3)の立体異性構成はそれぞれ(R、R)である、

請求項1~14のいずれかに記載の組成物。

**【請求項16】**

前記化合物が、式

**【化119】**



の化合物またはその医薬上許容される塩であり、

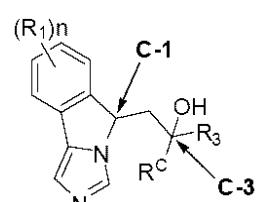
ここでは、炭素-1および炭素-3の立体異性構成はそれぞれ(R、S)である、

請求項1~14のいずれかに記載の組成物。

**【請求項17】**

前記化合物が、式

**【化120】**



の化合物またはその医薬上許容される塩であり、

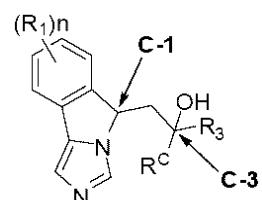
ここでは、炭素-1および炭素-3の立体異性構成はそれぞれ(S、R)である、

請求項1~14のいずれかに記載の組成物。

**【請求項18】**

前記化合物が、式

**【化121】**



の化合物またはその医薬上許容される塩であり、

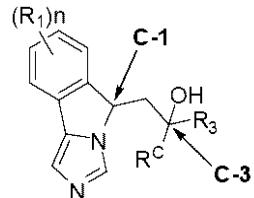
ここでは、炭素-1および炭素-3の立体異性構成はそれぞれ(S、S)である、

請求項1～14のいずれかに記載の組成物。

【請求項19】

前記化合物が、式

【化122】



の化合物またはその医薬上許容される塩であり、

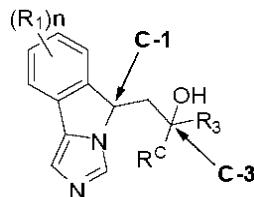
ここでは、炭素-1および炭素-3の立体異性構成はそれぞれ(S、R)または(S、S)であり、こ  
こでは、R<sup>3</sup>はシクロヘキシルであり、R<sup>31</sup>はORである、

請求項1～14のいずれかに記載の組成物。

【請求項20】

前記化合物が、式

【化123】



の化合物またはその医薬上許容される塩であり、

ここでは、炭素-1および炭素-3の立体異性構成はそれぞれ(S、R)または(S、S)であり、こ  
こではR<sup>3</sup>はピペリジンであり、R<sup>31</sup>は-C(O)Rまたは-C(O)(NHR)である、

請求項1～14のいずれかに記載の組成物。

【請求項21】

前記化合物が、

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール；

エチル 2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)アセテート；

(E)-5-(2-ブロモスチリル)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール；

2-(6-クロロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-シクロヘキシルエタノー  
ル；

2-(6-クロロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-シクロヘキシルエタノン；

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル2-(((1R,2R,5S)-2-イソプロピル  
-5-メチルシクロヘキシル)オキシ)アセテート；

t-ブチル (4-(2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)アセチル)フェニル)カル  
バマート；

1-(4-アミノフェニル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノン；

t-ブチル (4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)フェニル)カルバマート；

1-(4-アミノフェニル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール；

1-シクロヘキシル-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール；

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(3-ニトロフェニル)エタノン；

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(3-ニトロフェニル)エタノール；

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(2-ニトロフェニル)エタノン；

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(2-ニトロフェニル)エタノール；

t-ブチル (2-(2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)アセチル)フェニル)カル  
バマート；

t-ブチル (2-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)フェニル)カルバマート;

1-(2-アミノフェニル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノン;

1-(2-アミノフェニル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

1-(2-クロロフェニル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノン;

1-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-2-メチルプロパン-2-オール;

1-(2-クロロフェニル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

1-(3-クロロフェニル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-フェニルエタノン;

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-フェニルエタノール;

1-(2,4-ジメチルフラン-3-イル)-2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

1-(3-クロロフェニル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノン;

1-シクロヘキシリ-2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノン;

1-シクロヘキシリ-2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)エタノール;

2-(7-クロロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-シクロヘキシリエタノール;

(Z)-1-シクロヘキシリ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノン オキシム;

1-シクロペンチル-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

t-ブチル 4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-カルボキシレート;

1-シクロヘキシリ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタンアミン;

t-ブチル (3-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)フェニル)カルバマート;

1-(3-アミノフェニル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

4-(2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキサノール;

1-シクロヘキシリ-2-(9-メトキシ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

5-(2-シクロヘキシリ-2-ヒドロキシエチル)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-9-オール;

2-(8-クロロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-シクロヘキシリエタノール;

1-(シクロヘキサ-1-エン-1-イル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

1-シクロヘキシリ-2-(8-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(1,4-ジオキサスピロ[4.5]デカン-8-イル)エタノール;

4-(2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキサン;

2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(4-メチレンシクロヘキシリ)エタノール;

1-(シクロヘキサ-3-エン-1-イル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

1-(4-(ヒドロキシメチル)シクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)(チオフェン-2-イル)メタノン;  
1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)エタノン;  
2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(4-メチレンシクロヘキシル)エタノール;  
2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(4-メチルシクロヘキシル)エタノール;  
2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(チアゾール-4-イル)エタノール;  
2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(チアゾール-5-イル)エタノール;  
1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-2,2-ジメチルプロパン-1-オン;  
2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(フラン-2-イル)エタノール;  
(1S)-1-シクロヘキシル-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
(1R)-1-シクロヘキシル-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(4-(ヨードメチレン)シクロヘキシル)エタノール;  
1-シクロヘキシル-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)プロパン-1-オール;  
2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)アセトニトリル;  
1-シクロヘキシル-3-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)プロパン-2-オール;  
1-シクロヘキシル-3-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)プロパン-2-オール;  
1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-2-フェニルエタノン;  
1-(4,4-ジフルオロシクロヘキシル)-2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
1-(4,4-ジフルオロシクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(1-メチル-1H-イミダゾ1-5-イル)エタノール;  
1-(4-(シクロプロピルメチレン)シクロヘキシル)-2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(4-(プロパン-2-イリデン)シクロヘキシル)エタノール;  
(E)-5-(2-シクロヘキシリビニル)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール;  
2-(9-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(4-メチルシクロヘキシル)エタノール;  
1-(シクロヘキサ-3-エン-1-イル)-2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
(S)-1-シクロヘキシル-2-((R)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
(R)-1-シクロヘキシル-2-((R)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
(R)-1-シクロヘキシル-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
(S)-1-シクロヘキシル-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

1-シクロヘキシリ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イリデン)エタノール;  
1-シクロヘキシリ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル アセテート;  
1-(4-(2-(ベンジルオキシ)エチリデン)シクロヘキシリ)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソイ  
ンドール-5-イル)エタノール;  
1-(1-(ベンジルスルホニル)ピペリジン-4-イル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソindo  
ル-5-イル)エタノール;  
1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジ  
ン-1-イル)-2-(ピリミジン-5-イル)エタノン;  
2-(3,4-ジフルオロフェニル)-1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソindo  
ル-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)エタノン;  
シクロヘキシリ(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチ  
ル)ピペリジン-1-イル)メタノン;  
メチル 4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シク  
ロヘキサンカルボキシレート;  
1-シクロヘキシリ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル フェニルカ  
ルバマート;  
4-(1-シクロヘキシリ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エトキシ)-4-オ  
キソブタン酸;  
4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキサ  
ノール;  
安息香酸1-シクロヘキシリ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル;  
4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-(2-(メチ  
ルスルホニアミド)エチル)シクロヘキサンカルボキサミド;  
(2S)-1-シクロヘキシリ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル-2-アミ  
ノ-3-メチルブタノエート;  
リン酸二水素1-シクロヘキシリ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル  
;  
4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキサ  
ンカルボン酸;  
1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジ  
ン-1-イル)-2-(ピリジン-4-イル)エタノン;  
2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(スピロ[2.5]オクタン-6-イル)エタ  
ノール;  
2-(4-フルオロフェニル)-1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソindo  
ル-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)エタノン;  
(2S)-1-シクロヘキシリ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル 2-アミ  
ノプロパノエート;  
1-(4-(2-ヒドロキシエチリデン)シクロヘキシリ)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソindo  
ル-5-イル)エタノール;  
(2S)-1-シクロヘキシリ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル ピロリ  
ジン-2-カルボキシレート;  
(2S)-5-(1-シクロヘキシリ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル) 1-  
メチル 2-アミノペンタジオエート;  
(3-フルオロ-2-ヒドロキシフェニル)(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソindo  
ル-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)メタノン;  
4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-フェニル  
ピペリジン-1-カルボキサミド;  
(4-フルオロフェニル)(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソindo  
ル-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)メタノン;  
(2S)-2-アミノ-1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソindo  
ル-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)メタノン;

チル)ピペリジン-1-イル)-3-フェニルプロパン-1-オン;  
(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)((S)-ピロリジン-2-イル)メタノン;  
安息香酸(1R,4s)-4-(2-((S)-6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキシリル;  
(1R,4s)-4-(2-((S)-6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキサノール;  
1-(3-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)アゼチジン-1-イル)-2-フェニルエタノン;  
3-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-フェニルアゼチジン-1-カルボキサミド;  
t-ブチル 3-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)アゼチジン-1-カルボキシレート  
1-(アゼチジン-3-イル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
t-ブチル 4-((S)-1-ヒドロキシ-2-((R)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-カルボキシレート;  
t-ブチル 4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((R)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-カルボキシレート;  
t-ブチル 4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-カルボキシレート;  
t-ブチル 4-((S)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-カルボキシレート;  
1-((1s,4s)-4-(ベンジルオキシ)シクロヘキシリル)-2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(ピリジン-3-イル)エタノール;  
(1r,4r)-4-(2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキサノール;  
4-((S)-1-ヒドロキシ-2-((R)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-フェニルピペリジン-1-カルボキサミド;  
4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((R)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-フェニルピペリジン-1-カルボキサミド;  
4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-フェニルピペリジン-1-カルボキサミド;  
4-((S)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-フェニルピペリジン-1-カルボキサミド;  
1-(4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-2-フェニルエタノン;  
1-(4-((S)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-2-フェニルエタノン;  
(1R,4s)-4-((S)-2-((R)-6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキサノール;  
(1S,4s)-4-((R)-2-((R)-6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキサノール;  
(1S,4s)-4-((R)-2-((S)-6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキサノール;  
(1R,4s)-4-((S)-2-((S)-6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキサノール;  
(1S,4r)-4-((S)-2-((R)-6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキサノール;  
(1S,4r)-4-((S)-2-((S)-6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキサノール;

ドロキシエチル)シクロヘキサノール;

(1R,4r)-4-((R)-2-((S)-6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒ

ドロキシエチル)シクロヘキサノール;

(1R,4r)-4-((R)-2-((R)-6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒ

ドロキシエチル)シクロヘキサノール;

1-(4-((S)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)

ピペリジン-1-イル)-2-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)エタノン;

1-(4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((R)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)

ピペリジン-1-イル)-2-フェニルエタノン;

N-((1s,4s)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)

シクロヘキシル)ベンズアミド;

1-(4-((S)-1-ヒドロキシ-2-((R)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)

ピペリジン-1-イル)-2-フェニルエタノン;

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(1-(フェニルカルバモイル)ピペリ  
ジン-4-イル)エチル フェニルカルバマート;

4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-(  
(1r,4R)-4-ヒドロキシシクロヘキシル)ピペリジン-1-カルボキサミド;

4-((S)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-(  
テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)ピペリジン-1-カルボキサミド;

4-((S)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-(  
(1r,4S)-4-ヒドロキシシクロヘキシル)ピペリジン-1-カルボキサミド;

1-((1r,4r)-4-(ベンジルオキシ)シクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドー  
ル-5-イル)エタノール;

1-((1r,4r)-4-(ベンジルオキシ)シクロヘキシル)-2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]  
イソインドール-5-イル)エタノール;

1-(4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)  
ピペリジン-1-イル)-2-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)エタノン;

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(ピリジン-4-イル)エタノール;

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(ピリジン-2-イル)エタノール;

4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-(  
テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)ピペリジン-1-カルボキサミド;

N-シクロヘキシル-4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5  
-イル)エチル)ピペリジン-1-カルボキサミド;

N-((1r,4r)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)  
シクロヘキシル)ベンズアミド;

N-シクロペンチル-4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5  
-イル)エチル)ピペリジン-1-カルボキサミド;

2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(4-(トリフルオロメチ  
ル)シクロヘキシル)エタノール;

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(4-(トリフルオロメチル)シクロヘ  
キシル)エタノール;

1-(4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)  
ピペリジン-1-イル)-2-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)エタノン;

4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-(  
4-(トリフルオロメチル)フェニル)ピペリジン-1-カルボキサミド;

(4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピ  
ペリジン-1-イル)(1H-イミダゾ[1-1-イル)メタノン;

1-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-3-メチルブタン-2-オール;

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(テトラヒドロ-2H-ピラン-3-イル)  
エタノール;

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(ピペリジン-3-イル)エタノール;  
1-シクロヘキシル-2-((R)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
1-シクロヘキシル-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
1-シクロヘキシル-3-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)プロパン-1-オール;  
1-シクロヘキシル-2-(9-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
N-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)フェニル)  
-2-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)アセトアミド;  
2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(1H-イミダゾ[1-2-イル]エタノール;  
2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(1H-イミダゾ[1-4-イル]エタノール;  
2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(チアゾール-2-イル)エタノール;  
(5S)-5-(2-シクロヘキシル-2-ヒドロキシエチル)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-  
6-オール;  
1-(2-アミノシクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノー  
ル;  
N-(1-シクロヘキシル-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)アセトア  
ミド;  
N-(2-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘ  
キシル)アセトアミド;  
1-シクロヘキシル-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-N-メチルエタンア  
ミン;  
2-((1-シクロヘキシル-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ア  
ミノ)エタンスルホンアミド;  
2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(1-メチルピペリジン-4  
-イル)エタノール;  
1-(4-アミノシクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノー  
ル;  
N-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘ  
キシル)アセトアミド;

1-((1r,4r)-4-((6-アミノピリジン-3-イル)メトキシ)シクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

1-((1r,4r)-4-((3-アミノピリジン-2-イル)メトキシ)シクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

1-((1r,4r)-4-((2-アミノピリミジン-5-イル)メトキシ)シクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

1-((1r,4r)-4-((4-アミノピリミジン-5-イル)メトキシ)シクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

1-((1r,4r)-4-((5-アミノピリジン-2-イル)メトキシ)シクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

4-(((1r,4r)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキシル)オキシ)メチル)-N,N-ジメチルベンズアミド;

3-(((1r,4r)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキシル)オキシ)メチル)-N,N-ジメチルベンズアミド;

2-(((1r,4r)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキシル)オキシ)メチル)-N,N-ジメチルベンズアミド;

4-(((1r,4r)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキシル)オキシ)メチル)ベンゼンスルホンアミド;

3-(((1r,4r)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキシル)オキシ)メチル)ベンゼンスルホンアミド;

2-(((1r,4r)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキシル)オキシ)メチル)ベンゼンスルホンアミド;

4-(((1r,4r)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキシル)オキシ)メチル)ベンズアミド;

3-(((1r,4r)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキシル)オキシ)メチル)ベンズアミド;

2-(((1r,4r)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキシル)オキシ)メチル)ベンズアミド;

4-(((1r,4r)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキシル)オキシ)メチル)安息香酸メチル;

3-(((1r,4r)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキシル)オキシ)メチル)安息香酸メチル;

2-(((1r,4r)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキシル)オキシ)メチル)安息香酸メチル;

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-((1r,4r)-4-メトキシシクロヘキシル)エタノール;

1-((1r,4r)-4-エトキシシクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-((1r,4r)-4-イソプロポキシシクロヘキシル)エタノール;

1-((1r,4r)-4-(シクロプロピルメトキシ)シクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

1-((1r,4r)-4-(シクロペンチルメトキシ)シクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-((1r,4r)-4-(チオフェン-2-イルメトキシ)シクロヘキシル)エタノール;

1-((1r,4r)-4-((1H-インドール-3-イル)オキシ)シクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

1-((1r,4r)-4-((1H-インドール-5-イル)オキシ)シクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(4-((テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)メトキシ)シクロヘキシル)エタノール;  
4-(((4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキシル)オキシ)メチル)ベンゼンスルホンアミド;  
2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(4-(オキサゾール-2-イルメトキシ)シクロヘキシル)エタノール;  
2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(4-(チアゾール-2-イルメトキシ)シクロヘキシル)エタノール;  
2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(1-(1-イミノ-2-フェニルエチル)ピペリジン-4-イル)エタノール;  
4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-フェニルピペリジン-1-カルボキシミドアミド;  
4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-(ピリジン-4-イル)ピペリジン-1-カルボキシミドアミド;  
4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-(テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル)ピペリジン-1-カルボキシミドアミド;  
N-(4-シアノフェニル)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-カルボキサミド;  
N-(t-ブチル)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-カルボキサミド;  
N-(t-ブチル)-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-スルホンアミド;  
1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-2-(3-ヒドロキシフェニル)エタノン;  
2-(1-(アゼチジン-1-カルボニル)ピペリジン-4-イル)-2-ヒドロキシ-1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)エタノン;  
2-シクロペンチル-1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)エタノン;  
1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-2-(2-メチルチアゾール-5-イル)エタノン;  
N-シクロヘキシル-N-ヒドロキシ-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-カルボキサミド;  
N-(4-(2-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-2-オキソエチル)フェニル)メタンスルホンアミド;  
N-シクロプロピル-N-ヒドロキシ-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-カルボキサミド;  
3,3-ジフルオロ-1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)ブタン-1-オン;  
1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-2-(p-トリル)エタノン;  
1-(1-(4-アミノピリミジン-2-イル)ピペリジン-4-イル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
1-(1-(2-アミノピリミジン-4-イル)ピペリジン-4-イル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール;  
N-シクロプロピル-4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-カルボキサミド;  
2-シクロプロピル-1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)エタノン;  
2-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)シクロヘキシリデン)アセトニトリル;

4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-(4-(トリフルオロメチル)チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-カルボキサミド；

4-(2-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-2-オキソエチル)ベンズアミド；

1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-2-(4-(メチルスルホニル)フェニル)エタノン；

4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-((1r,4r)-4-メチルシクロヘキシル)ピペリジン-1-カルボキサミド；

1-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-3,3-ジメチルブタン-1-オン；

4-(2-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-2-オキソエチル)ベンゼンスルホンアミド；

N-(t-ブチル)-4-(2-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-2-オキソエチル)ベンゼンスルホンアミド；

安息香酸4-(2-(4-(1-ヒドロキシ-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-2-オキソエチル)；

1-(4-(ジフルオロメチレン)シクロヘキシル)-2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール；

2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-(4-(2,2,2-トリフルオロエチリデン)シクロヘキシル)エタノール；

N-ベンジル-4-(2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキサンカルボキサミド；

4-(2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)-N-フェニルシクロヘキサンカルボキサミド；

N-(4-(2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキシル)ベンズアミド；

1-(4-(2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキシル)-3-フェニル尿素；

N-(4-(2-(6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキシル)-2-フェニルアセトアミド；

またはその医薬上許容される塩である、請求項1に記載の組成物。

### 【請求項22】

前記化合物が、

4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)-N-フェニルピペリジン-1-カルボキサミド；

1-(4-((R)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-2-フェニルエタノン；

1-(4-((S)-1-ヒドロキシ-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)-2-フェニルエタノン；

(S)-1-シクロヘキシル-2-((S)-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)エタノール；

(1R,4r)-4-((R)-2-((S)-6-フルオロ-5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-ヒドロキシエチル)シクロヘキサノール

またはその医薬上許容される塩である、請求項1に記載の組成物。

### 【請求項23】

請求項1～22のいずれかに記載の組成物であって、該組成物が、約5mg～約100mgの前記化合物を含む、組成物。

### 【請求項24】

請求項1～22のいずれかに記載の組成物であって、該組成物が、約10mg～約30mgの前記化合物を含む、組成物。

**【請求項 25】**

迅速放出製剤としての請求項1～24のいずれかに記載の組成物。

**【請求項 26】**

持続放出製剤としての請求項1～24のいずれかに記載の組成物。

**【請求項 27】**

遅延放出製剤としての請求項1～24のいずれかに記載の組成物。

**【請求項 28】**

請求項1～27のいずれかに記載の組成物を含み、さらに1つ以上の追加の治療薬を含む、組み合わせ物。

**【請求項 29】**

前記治療薬が、化学療法薬または他の抗癌剤である、請求項28に記載の組み合わせ物。

**【請求項 30】**

前記化学療法薬または他の抗癌剤が、(a)アルキル化剤、(b)代謝拮抗薬、(c)細胞傷害性薬物、(d)共刺激分子またはサイトカインに対する抗体、(e)免疫細胞遊走阻害剤、(f)ケモカイン受容体のアンタゴニスト、または(g)ワクチンである、請求項29に記載の組み合わせ物。

**【請求項 31】**

請求項29に記載の組み合わせ物であって、前記治療薬が、

a) 窒素マスター、エチレンイミン誘導体、アルキルスルホナート、ニトロソウレア、トリアジン；

b) 葉酸アンタゴニスト、ピリミジンアナログ、プリンアナログ、アデノシンデアミナーゼ阻害剤；

c) ピンカルカルカロイド、抗腫瘍抗生物質、酵素、リンホカイン、エピポドフィロトキシン；

d) 抗悪性腫瘍性酵素；トポイソメラーゼ阻害剤；プラチナ配位錯体；生理学的応答修飾物質；成長阻害剤；抗ホルモン治療薬；造血性増殖因子；

e) IL-10に対する抗体、TGF- $\beta$ に対する抗体；

f) 共刺激分子CTLA-4、4-1BBまたはPD-1に対する抗体；

g) サイトカインIL-10またはTGF- $\beta$ に対する抗体；

h) CCR2、CCR4またはCCR6に対するアンタゴニスト；ならびに

i) 樹状細胞、合成ペプチド、DNA ワクチンまたは組換えウィルスを含むワクチンからなる群より選択される、組み合わせ物。

**【請求項 32】**

請求項29に記載の組み合わせ物であって、前記治療薬が、

a) ウラシルマスター、クロルメチン、シクロホスファミド(Cytoxan<sup>TM</sup>)、イフォフアミド、メルファン、クロラムブシル、ピポブロマン、トリエチレン-メラミン、トリエチレンチオホスホラミン、ブスルファン、カルムスチン、ロムスチン、ストレプトゾシン、ダカルバジン、テモゾロミド；

b) メトレキサート、5-フルオロウラシル、フロクスリジン、シタラビン、6-メルカブトプリン、6-チオグアニン、フルダラビンホスファート、ペントスタチン、ゲムシタビン；

c) ピンプラスチニン、ピンクリスチニン、ピンデシン、ブレオマイシン、ダクチノマイシン、ダウノルビシン、ドキソルビシン、エピルビシン、イダルビシン、アラ-C、パクリタキセル(Taxol<sup>TM</sup>)、ドセタキセル、ミトラマイシン、デオキシコ-フォルマイシン、マイトイマイシン-C、L-アスパラギナーゼ、インターフェロン、IFN- $\alpha$ 、エトポシド、テニボシド；

d) ナベルベン、CPT-11、アナストラゾール、レトラゾール、カペシタビン、レロキサフィン、シクロホスファミド、イフォサミド、ドロロキサフィン；

e) エピドフィロトキシン；プロカルバジン；ミトキサントロン；シスプラチニン；カルボプラチニン；ロイコボリン；テガフル；ならびに

f ) トラスツズマブ

からなる群より選択される、組み合わせ物。

**【請求項 3 3】**

必要な被験体において、

- a ) インドールアミン2,3-ジオキシゲナーゼ(IDO)媒介免疫抑制を治療するため、
- b ) T細胞増殖を刺激するため、
- c ) アネルギーの免疫状態を逆転するため、
- d ) IDOを発現する細胞においてトリプトファンの分解を阻害するため、
- e ) 細胞外トリプトファンレベルを変化させるため、または
- f ) IDO-関連疾患または症状の治療のため

の請求項1～27のいずれかに記載の組成物または請求項28～32のいずれかに記載の組み合  
わせ物。

**【請求項 3 4】**

請求項33に記載の組成物または組み合わせ物であって、インドールアミン2,3-ジオキシゲ  
ナーゼ(IDO)媒介免疫抑制を治療するためである、組成物または組み合わせ物。

**【請求項 3 5】**

請求項34に記載の組成物または組み合わせ物であって、前記インドールアミン2,3-ジオキ  
シゲナーゼ(IDO)媒介免疫抑制が、癌または癌の処置と関連する、組成物。

**【請求項 3 6】**

前記癌は、結腸癌、膵臓癌、乳癌、前立腺癌、肺癌、脳癌、卵巣癌、頸癌、精巣癌、腎癌  
、頭部癌、もしくは頸部癌、またはリンパ腫、白血病、もしくは黒色腫である、請求項35  
に記載の組成物または組み合わせ物。