

【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 07 D 487/04 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 37/04 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 31/00 (2006.01)

A 61 P 31/14 (2006.01)

A 61 P 31/18 (2006.01)

A 61 P 31/16 (2006.01)

A 61 P 31/20 (2006.01)

A 61 P 31/12 (2006.01)

A 61 P 35/02 (2006.01)

A 61 K 31/4188 (2006.01)

A 61 K 31/454 (2006.01)

A 61 K 31/4439 (2006.01)

A 61 K 31/506 (2006.01)

A 61 K 31/427 (2006.01)

A 61 K 31/4545 (2006.01)

A 61 K 31/675 (2006.01)

C 07 F 9/6561 (2006.01)

C 12 N 9/99 (2006.01)

C 12 N 15/09 (2006.01)

【F I】

C 07 D 487/04 1 3 8

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 37/04

A 61 P 35/00

A 61 P 31/00

A 61 P 31/14

A 61 P 31/18

A 61 P 31/16

A 61 P 31/20

A 61 P 31/12

A 61 P 35/02

A 61 K 31/4188

A 61 K 31/454

A 61 K 31/4439

A 61 K 31/506

A 61 K 31/427

A 61 K 31/4545

A 61 P 43/00 1 2 3

A 61 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】

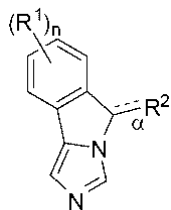
【特許請求の範囲】

【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<sup>1</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>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<sup>2</sup>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<sup>2</sup>は=C(H)R<sup>A</sup>であり、

ここでは、

R<sup>A</sup>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<sup>B</sup>は水素、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>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<sup>B1</sup>はシアノ、ニトロ、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、-OR、-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>D</sup>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、単環C<sub>3-8</sub>シクロアルキルまたは単環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。

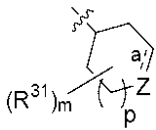
## 【請求項 7】

$R^3$ 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 1 1 5】



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  $R^{31}$  基と置換され、

ここでは、

$R^{31}$  は独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_{1-6}$  アルキル、 $-C_{1-6}$  アルキル- $R^{33}$ 、 $C_{1-6}$  ハロアルキル、 $-OR$ 、 $-N(R)_2$ 、 $-SR$ 、 $-C(O)OR$ 、 $-C(O)N(R)_2$ 、 $-C(O)R$ 、 $-S(O)R$ 、 $-S(O)OR$ 、 $-S(O)N(R)_2$ 、 $-S(O)_2R$ 、 $-S(O)_2OR$ 、 $-S(O)_2N(R)_2$ 、 $-OC(O)R$ 、 $-OC(O)OR$ 、 $-OC(O)N(R)_2$ 、 $-N(R)C(O)R$ 、 $-N(R)C(O)OR$ 、 $-N(R)C(O)N(R)_2$  であり、ここでは、 $R^{33}$  は  $-OR$ 、 $-N(R)_2$ 、または  $-SR$  であり、

$R^{32}$  はオキソ、 $=C(R^{34})_2$ 、 $=(\text{スピロ-}C_{3-8}\text{シクロアルキル})$ 、または $=(\text{スピロ-(3-10員環ヘテロシクリル)})$  であり、ここでは、

$R^{34}$  はそれぞれ独立して水素、ハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル、または  $C_{3-8}$  シクロアルキルであり、

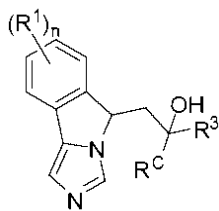
$R^C$  は水素または  $C_{1-6}$  アルキルである、

請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 1 2】

前記化合物が、式

【化 1 1 6】



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 1 3】

$R^3$  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、または 3-10 員環ヘテロシクリルであり、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、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  $=R^{32}$  基および、1、2、3 または 4 つの  $R^{31}$  基と置換され、

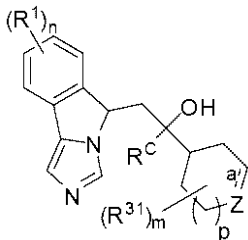
該アリールおよび該ヘテロアリールはそれぞれ任意に 1、2、3 または 4 つの  $R^{31}$  基と置換される、

請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 1 4】

前記化合物が、式

【化 1 1 7】



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  $-C(R^{36})_2-$ 、 $-C(=R^{32})-$ 、 $-N(R^{35})-$ 、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、

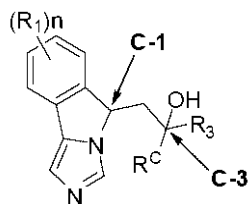
$R^{36}$ はそれぞれ独立して水素または $R^{31}$ である、

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、

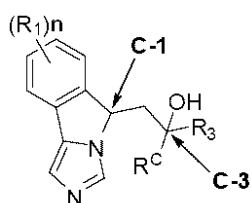
ここでは、炭素-1(C-1)および炭素-3(C-3)の立体異性構成はそれぞれ(R, R)である、

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、

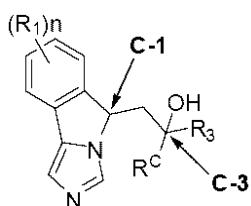
ここでは、炭素-1および炭素-3の立体異性構成はそれぞれ(R, S)である、

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、

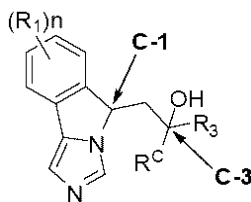
ここでは、炭素-1および炭素-3の立体異性構成はそれぞれ(S, R)である、

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、

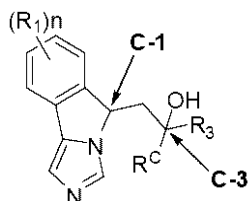
ここでは、炭素-1および炭素-3の立体異性構成はそれぞれ(S, S)である、

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

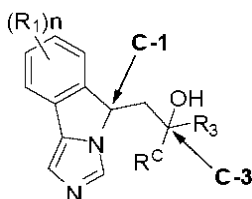
こでは、R<sup>3</sup>はシクロヘキシルであり、R<sup>31</sup>はORである、

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-プロモスチリル)-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)エタノン;

1-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-(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-シクロヘキシルエタノール;

(Z)-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-シクロヘキシル-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-シクロヘキシル-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-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-シクロヘキシルエタノール;

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-シクロヘキシル-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)シクロヘキサノン;

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ル)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)(チオフエン-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-シクロヘキシルビニル)-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-シクロヘキシル-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 アセテート;  
1-(4-(2-(ベンジルオキシ)エチリデン)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;  
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]イソインドール-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-(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]イソインドール-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)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  
ロヘキサカルボキシレート;  
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 フェニルカ  
ルバマート;  
4-(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-シクロヘキシル-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  
ルスルホンアミド)エチル)シクロヘキサカルボキサミド;  
(2S)-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-2-アミ  
ノ-3-メチルブタノエート;  
リン酸二水素1-シクロヘキシル-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]イソインドール-5-イル)エチル)ピペリジン-1-イル)エタノン;  
(2S)-1-シクロヘキシル-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;  
(2S)-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 ピロリ  
ジン-2-カルボキシレート;  
(2S)-5-(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) 1-  
メチル 2-アミノペンタンジオエート;  
(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]イソイ  
ンドール-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]イソインドール-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]イソインドール-5-イル)エ

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-((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;

(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-(4-(アミノメチル)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)シクロヘキサノカルボキサミド;  
1-(3-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;  
2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-((1r,4r)-4-(ピリジン-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-((1r,4r)-4-(ピリジン-3-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-((1r,4r)-4-(ピリジン-4-イルメトキシ)シクロヘキシル)エタノール;  
1-((1r,4r)-4-((2-アミノピリジン-4-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;  
2-(5H-イミダゾ[5,1-a]イソインドール-5-イル)-1-((1r,4r)-4-(ピラジン-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-((1r,4r)-4-(ピリミジン-5-イルメトキシ)シクロヘキシル)エタノール;  
1-((1r,4r)-4-((6-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-((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-(チオフエン-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-カルボキシイミドアミド;

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-カルボキシイミドアミド;

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-カルボキシイミドアミド;

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-((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 2 2】

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-フェニルエタノール;

(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;

(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 2 3】

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 2 4】

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) 窒素マスタード、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) ビンカルカロイド、抗腫瘍抗生物質、酵素、リンホカイン、エピドフィロトキシン；

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イ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) ウラシルマスタード、クロルメチン、シクロホスファミド(Cytosan<sup>TM</sup>)、イフォファミド、メルファラン、クロラムブシル、ピボプロマン、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-メルカプトプリン、6-チオグアニン、フルダラビンホスファート、ベントスタチン、ゲムシタビン；

c) ビンブラスチン、ピンクリスチン、ビンデシン、プレオマイシン、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、マイトマイシン-C、L-アスパラギナーゼ、インターフェロン、IFN- $\gamma$ 、エトポシド、テニポシド；

d) ナベルペン、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；シスプラチン；カルボプラチン；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 33】

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 34】

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 35】

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 36】

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。