

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成18年4月13日(2006.4.13)

【公表番号】特表2005-529134(P2005-529134A)

【公表日】平成17年9月29日(2005.9.29)

【年通号数】公開・登録公報2005-038

【出願番号】特願2003-587779(P2003-587779)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/404 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 209/42 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 409/12 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 11/02

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 209/42

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 409/12

【手続補正書】

【提出日】平成18年2月17日(2006.2.17)

【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

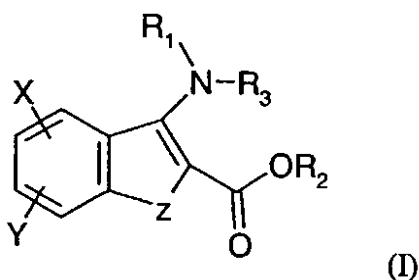
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

アレルギー、喘息、鼻炎、皮膚炎、B細胞リンパ腫、腫瘍または細菌、ライノウィルスもしくは呼吸器合胞体ウィルス(RSV)感染に関わる疾患の治療において有用な医薬組成物の製造のための下記式I:

【化1】



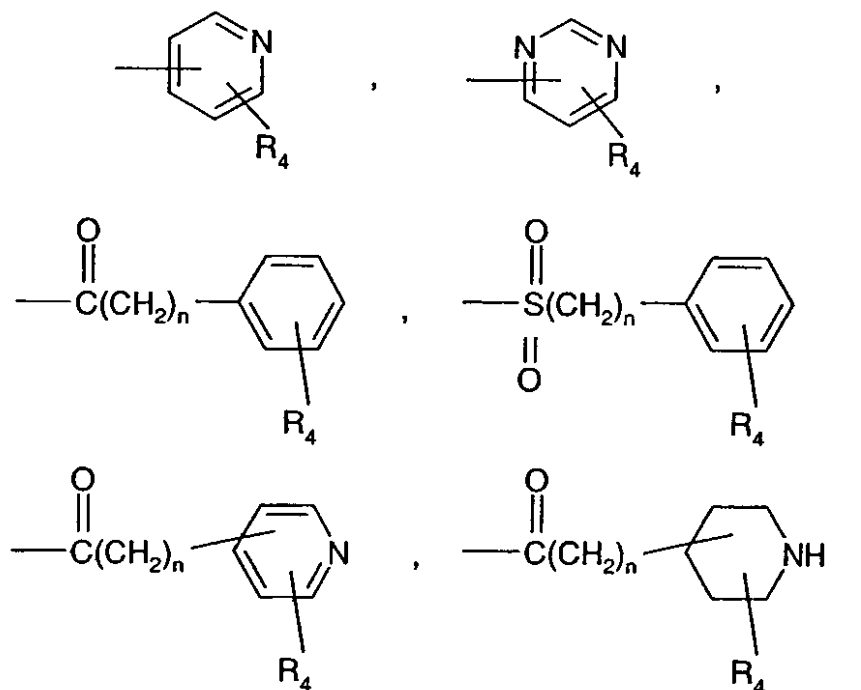
[式中、XおよびYは同じかまたは異なっていて、独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} パーフルオロアルキル、 C_{1-6} パーフルオロアルコキシ、フェニルおよびベンジルよりなる群から選択され、ここでフェニルまたはベンジルは場合により C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} パーフルオロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシまたは C_{1-6} パーフルオロアルキルまたは C_{1-6} パーフルオロアルコキシから各々独立して選択される置換基1個または2個で置換されており；

ZはN-RまたはSであり、ここでRは水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルキルカルボニル、 C_{1-6} アルコシカルボニル C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルキルカルバモイル- C_{1-6} アルキルおよび C_{1-6} ジアルキルカルバモイル C_{1-6} アルキルよりなる群から選択され；

R_1 は水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} パーフルオロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ C_{1-6} アルキル、アミノ C_{1-6} アルキル、モノ-またはジ- C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルキル、ホルミル、 C_{1-6} アルキルカルボニル、アミノ C_{1-6} アルキルカルボニル、 C_{1-6} アルコシカルボニル、フェニル、ジフェニル C_{1-6} アルキルおよびフェニル C_{1-6} アルキル、フェニルカルボニル C_{1-6} アルキル、フェノキシ C_{1-6} アルキルよりなる群から選択され、ここでフェニルは場合により C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} パーフルオロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシまたは C_{1-6} パーフルオロアルキルまたは C_{1-6} パーフルオロアルコキシから各々独立して選択される置換基1個または2個で置換されており；

R_3 は下記式：

【化 2】

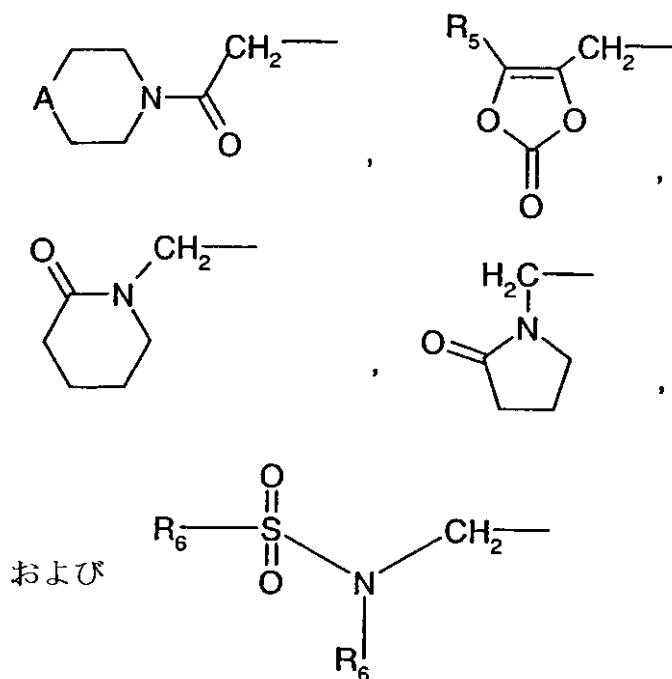


(式中、 R_4 は水素、ハロゲン、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} パーフルオロアルキル、 C_{1-6} パーフルオロアルコキシ、フェニルおよびベンジルよりなる群から選択され、ここでフェニルまたはベンジルは場合により、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} パーフルオロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシまたは C_{1-6} パーフルオロアルキルまたは C_{1-6} パーフルオロアルコキシから各々独立して選択される置換基1個または2個で置換されており；そして、

n は0～4の整数である)であり；そして、

R_2 は水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} パーフルオロアルキル、パーフルオロアリール、インダニル、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アシルオキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシカルボニルオキシ C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルコキシカルボニルオキシ C_{1-6} アルキル、アダマンチルオキシカルボニルオキシ C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} シクロアルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル、モノーまたはジ- C_{1-6} アルキルアミノ C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} アザシクロアルキル C_{1-6} アルキル、モノーまたはジ- C_{1-6} アルキルカルバモイル C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} アザシクロアルキルカルボニルオキシ C_{1-6} アルキル、ベンジル C_{1-6} アルキルカルバモイル C_{1-6} アルキル、モノーまたはジ- C_{1-6} アルキルカルバモイルオキシ C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} アザシクロアルキルカルボニルオキシ C_{1-6} アルキル、ベンジル C_{1-6} アルキルカルバモイルオキシ C_{1-6} アルキル、ベンジルカルバモイルオキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシカルボニルアミノオキシ C_{1-6} アルキル、下記式：

【化 3】



(式中、

R_5 は水素または C_{1-6} アルキルであり、

R_6 は C_{1-6} アルキル、フェニルまたはトリルであり、そして、

Aは CH_2 、NHまたはOである)よりなる群から選択される]の化合物の、または製薬上許容しうるその塩の、場合により、製薬上許容しうる担体と組み合わせた使用。

【請求項 2】

治療がアレルギーのためのものである請求項 1 記載の使用。

【請求項 3】

治療が喘息のためのものである請求項 1 記載の使用。

【請求項 4】

治療が鼻炎のためのものである請求項 1 記載の使用。

【請求項 5】

治療が皮膚炎のためのものである請求項 1 記載の使用。

【請求項 6】

治療がライノウィルスまたは呼吸器合胞体ウィルス感染に関わる疾患のためのものである請求項 1 記載の使用。

【請求項 7】

式 I において、

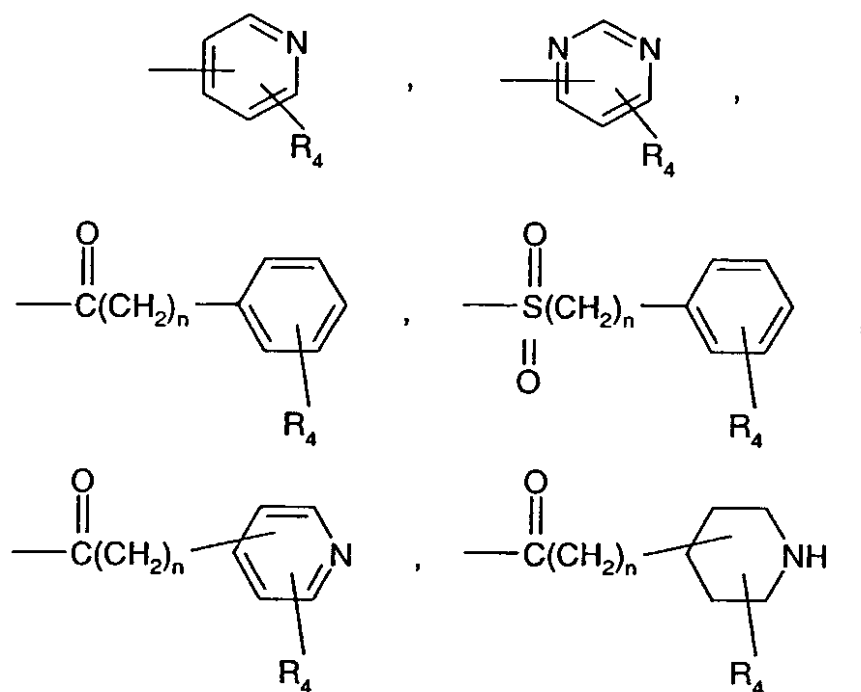
XおよびYは同じかまたは異なっていて、そして独立して、水素、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} パーフルオロアルキル、 C_{1-3} アルコキシ、 C_{1-3} パーフルオロアルコキシ、フェニルおよびベンジルよりなる群から選択され；

ZはN-RまたはSであり、ここでRは水素、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコシカルボニル C_{1-3} アルキルおよび C_{1-3} ジアルキルカルバモイル- C_{1-3} アルキルよりなる群から選択され；

R_1 は水素、 C_{1-6} アルキル、またはフェニル C_{1-6} アルキルであり；

R_3 は下記式：

【化 4】

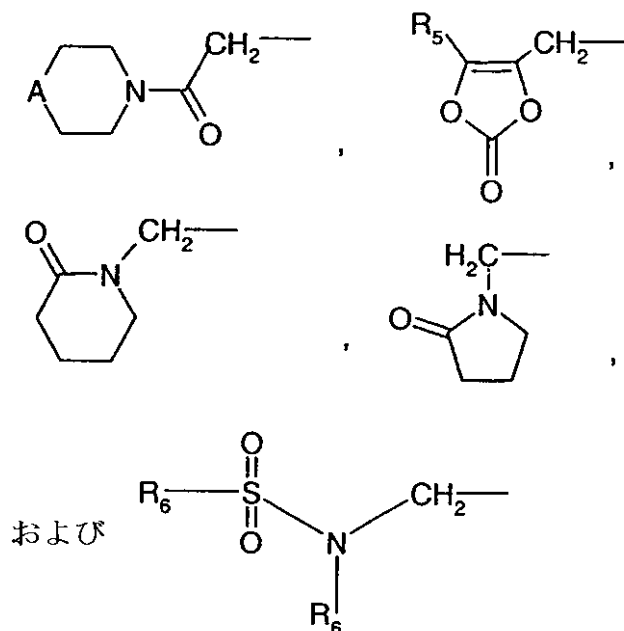


(式中、

 R_4 は水素、フッ素または C_{1-6} アルキルであり；そして、 n は0～3の整数である)であり；そして、

R_2 は水素、 C_{1-4} アルキル、パーフルオロアリール、インダニル、 C_{1-3} アルコキシ C_{1-3} アルキル、 C_{2-5} アシルオキシ C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコシカルボニル C_{1-3} アルキル、 C_{1-4} アルコシカルボニルオキシ C_{1-4} アルキル、 C_{4-6} シクロアルコシカルボニルオキシ C_{1-3} アルキル、アダマンチルオキシカルボニルオキシ C_{1-3} アルキル、モノーまたはジ C_{1-3} アルキルアミノ C_{1-3} アルキル、 C_{4-6} アザシクロアルキル C_{1-3} アルキル、モノーまたはジ C_{1-3} アルキルカルバモイル C_{1-3} アルキル、 C_{4-6} アザシクロアルキルカルボニル C_{1-3} アルキル、ベンジル C_{1-3} アルキルカルバモイル C_{1-6} アルキル、モノーまたはジ C_{1-3} アルキルカルバモイルオキシ C_{1-3} アルキル、 C_{3-8} アザシクロアルキルカルボニルオキシ C_{1-6} アルキル、ベンジルカルバモイルオキシ C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコシカルボニルアミノカルボニル C_{1-3} アルキル、下記式：

【化 5】



(式中、

R_5 は水素または C_{1-3} アルキルであり、

R_6 は C_{1-6} アルキル、フェニルまたはトリルであり、そして、

A は O である) よりなる群から選択される、

化合物の、または製薬上許容しうるその塩の、場合により製薬上許容しうる担体と組み合わせた請求項 1 記載の使用。

【請求項 8】

式 I において、

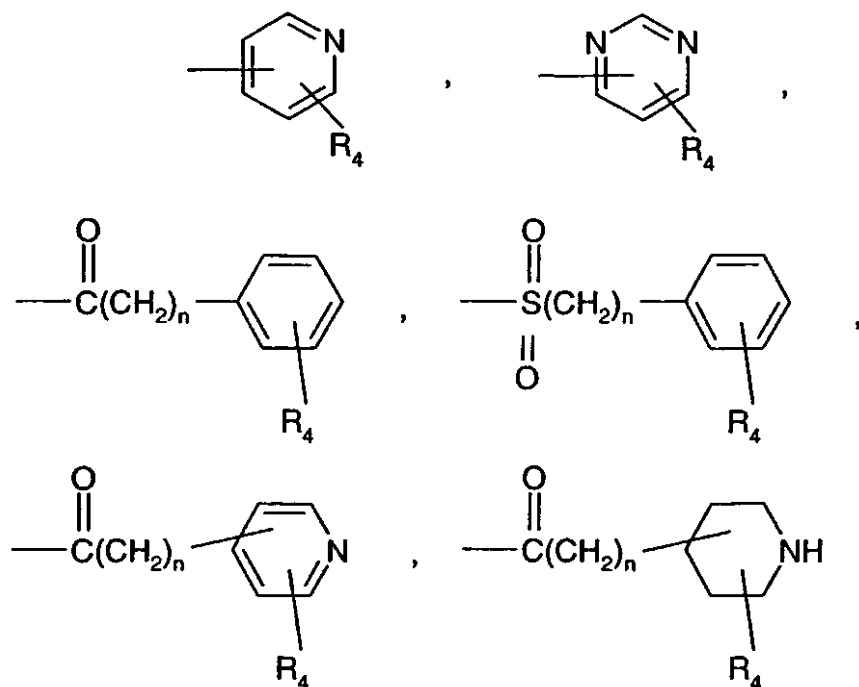
X および Y は同じかまたは異なっていて、そして独立して水素、フッ素、塩素、トリフルオロメチル、メトキシ、フェニルおよびベンジルよりなる群から選択され；

Z は N-R または S であり、ここで R は水素、メチル、エトキシカルボニルメチルおよびジエチルカルバモイルメチルよりなる群から選択され；

R_1 は水素、メチルまたはプロピルであり；

R_3 は下記式：

【化 6】

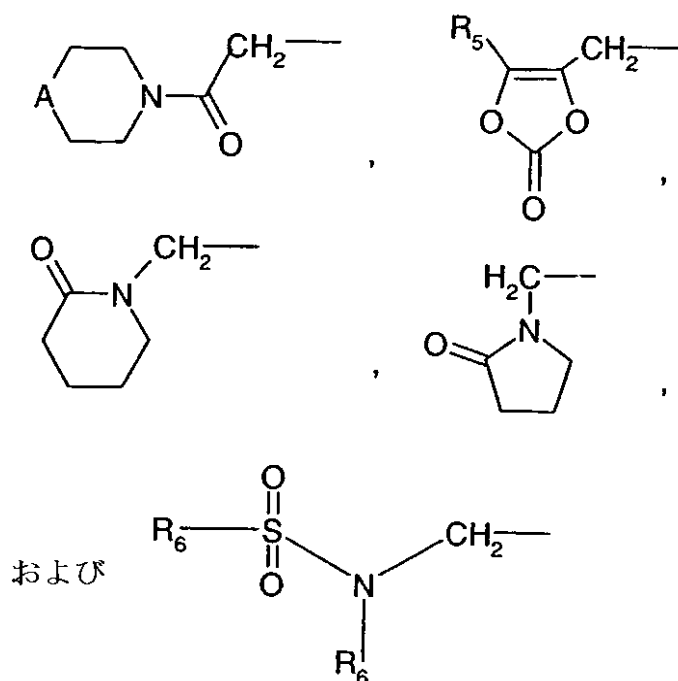


(式中、

 R_4 は水素であり；そして、 n は0～2の整数である)であり；そして、

R_2 は水素、メチル、エチル、*t*-ブチル、ペンタフルオロフェニル、インダニル、メトキシエチル、エトキシプロピル、アセチルオキシメチル、2, 2-ジメチルプロピオニルオキシメチル、ペンタノイルオキシメチル、メトキシカルボニル-1-エチル、エトキシカルボニルメチル、イソプロポキシカルボニルオキシメチル、*t*-ブトキシカルボニルオキシメチル、シクロヘキサノキシカルボニルオキシメチル、アダマンチルオキシカルボニルオキシメチル、ジエチルアミノエチル、ジメチルアミノエチル、ピペリジニル-1-エチル、ジエチルカルバモイルメチル、ベンジルエチルカルバモイルメチル、2-アゼチジン-1-イル-2-オキソ-エチル、2-オキソ-2-ピロリジン-1-イル-エチル、ピペリジン-1-カルボニルオキシメチル、ジエチルカルバモイルオキシメチル、ベンジルカルバモイルオキシメチル、エトキシカルボニルアミノ-カルボニルメチル、下記式：

【化 7】



(式中、

R_5 は水素またはメチルであり、

R_6 はメチル、フェニルまたはトリルであり、そして、

AはOである)よりなる群から選択される、

化合物の、または製薬上許容しうるその塩の、場合により製薬上許容しうる担体と組み合わせた請求項1記載の使用。

【請求項9】

化合物が下記：

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル

、

6-トリフルオロメチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

6-クロロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

5-クロロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

6-フルオロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

5-フルオロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

4-フルオロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、t-ブチルエステル、

6-フェニル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、t-ブチルエステル、

5,6-ジメトキシ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

3-メトキシ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、t-ブチルエステル、

3 - (2 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸、エチルエステル、

3 - (ピリミジン - 2 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸エチルエステル、

5 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸、エチルエステル、

4 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸、t - ブチルエステル、

5 - クロロ - 1 - メチル - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸、エチルエステル、

6 - クロロ - 1 - メチル - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸、エチルエステル、

1 - メチル - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸マレーエート塩、

4 - フルオロ - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸トリフルオロアセテート塩、

4 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸トリフルオロアセテート塩、

5 - メトキシ - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸トリフルオロアセテート塩、

6 - クロロ - 1 - ジエチルカルバモイルメチル - 3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸エチルエステル、

3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸ペンタフルオロフェニルエステル、

3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸2 - ジエチルアミノ - エチルエステル、

3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸2 - ジメチルアミノ - エチルエステル、

3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸2 - ピペリジン - 1 - イル - エチルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸(S) - 1 - メトキシカルボニル - エチルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸エトキシカルボニルメチルエステル、

3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸2 - メトキシエチルエステル、

3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸3 - エトキシプロピルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸インダン - 5 - イルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸ジエチルカルバモイルメチルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸2 - モルホリン - 4 - イル - 2 - オキソ - エチルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸2 - オキソ - 2 - ピロリジン - 1 - イル - エチルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸2 - アゼチジン - 1 - イル - 2 - オキソ - エチルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸(ベンジル - エチル - カルバモイル) - メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸ジエチルカルバモイルオキシ-メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸ベンジルカルバモイルオキシ-メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸ピペリジン-1-カルボニルオキシ-メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸モルホリン-4-カルボニルオキシ-メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸2-エトキシカルボニルアミノ-2-オキシ-エチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸イソプロポキシカルボニルオキシ-メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸1, 1, 2-トリメチルプロポキシ-カルボニルオキシ-メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸シクロヘキシルオキシ-カルボニルオキシ-メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸アダマント-1-イルオキシカルボニルオキシ-メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸アセトキシ-メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸2, 2-ジメチル-プロピオニルオキシ-メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸ペンタノイルオキシ-メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸2-オキソ-ピペリジン-1-イルメチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸(ベンゾイル-エトキシカルボニルメチル-アミノ)-メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸2-オキソ-ピロリジン-1-イルメチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸5-メチル-2-オキソ-(1, 3)ジオキソ-4-イルメチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸(フェニル-(トルエン-4-スルホニル)-アミノ)-メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸(ベンゼンスルホニル-メチル-アミノ)-メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸(メチル-(トルエン-4-スルホニル)-アミノ)-メチルエステル、

3 - (ピリジン-4-イルアミノ) - 1 H-インドール-2-カルボン酸t-ブトキシカルボニルオキシ-メチルエステル、

3 - (4-ピリジニルアミノ)-ベンゾ(b)チオフェン-2-カルボン酸エチルエステル、

6-フルオロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-ベンゾ(b)チオフェン-2-カルボン酸エチルエステル、

エチル 3-((4-ピリジル)アミノ-N-メチル)-ベンゾ(b)チオフェニル-2-カルボキシレート、

3-(4-ピリジニルアミノ)-6-トリフルオロメチル-ベンゾ(b)チオフェン-2-カルボン酸メタンスルホネート塩、

3-(4-ピリジニルアミノ)-ベンゾ(b)チオフェン-2-カルボン酸塩酸塩、

3-(4-ピリジニルアミノ)-6-トリフルオロメチル-ベンゾ(b)チオフェン-

2-カルボン酸エチルエステル塩酸塩、

3-(プロピル-4-ピリジニルアミノ)-ベンゾ(b)チオフェン-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((3-フェニルプロパノイル)メチルアミノ)-1H-6-クロロインドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)アミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)アミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸2-ジメチルアミノエチルエステル、

3-((4-クロロベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)ベンジルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((4-ピペリジンアシル)メチルアミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-5,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)エチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-6-フルオロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((2-ベンジルベンゾイル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((3-フルオロベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)ベンジルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((フェニルスルホニル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((フェニルスルホニル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、および、

3-((フェニルスルホニル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸

よりなる群から選択される請求項1記載の使用。

【請求項10】

化合物が下記：

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((3-フェニルプロパノイル)メチルアミノ)-1H-6-クロロインドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)アミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-5,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-6-フルオロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((4-クロロベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール

ル-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)ベンジルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)エチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((2-ベンジルベンゾイル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((3-フルオロベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((4-ピペリジンアシル)メチルアミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((フェニルスルホニル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((フェニルスルホニル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

6-トリフルオロメチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

3-(ピリミジン-2-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((ベンゾイル)アミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸2-ジメチルアミノ-エチルエステル、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((ベンゾイル)ベンジルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、および、

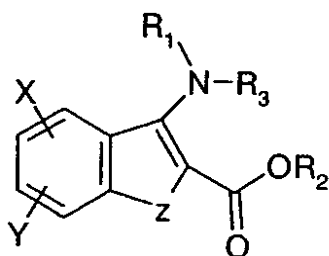
3-((フェニルスルホニル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル

よりなる群から選択される請求項1記載の使用。

【請求項11】

医薬組成物を製造するための下記式(I)：

【化8】



[式中、

XおよびYは同じかまたは異なっていて、そして独立して水素、ハロゲン、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆パーフルオロアルキル、C₁₋₆パーフルオロアルコキシ、フェニルおよびベンジルよりなる群から選択され、ここで、フェニルまたはベンジルは場合によりC₁₋₆アルキル、C₁₋₆パーフルオロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシまたはC₁₋₆パーフルオロアルキルまたはC₁₋₆パーフルオロアルコキシから各々独立して選択される置換基1個または2個で置換されており；

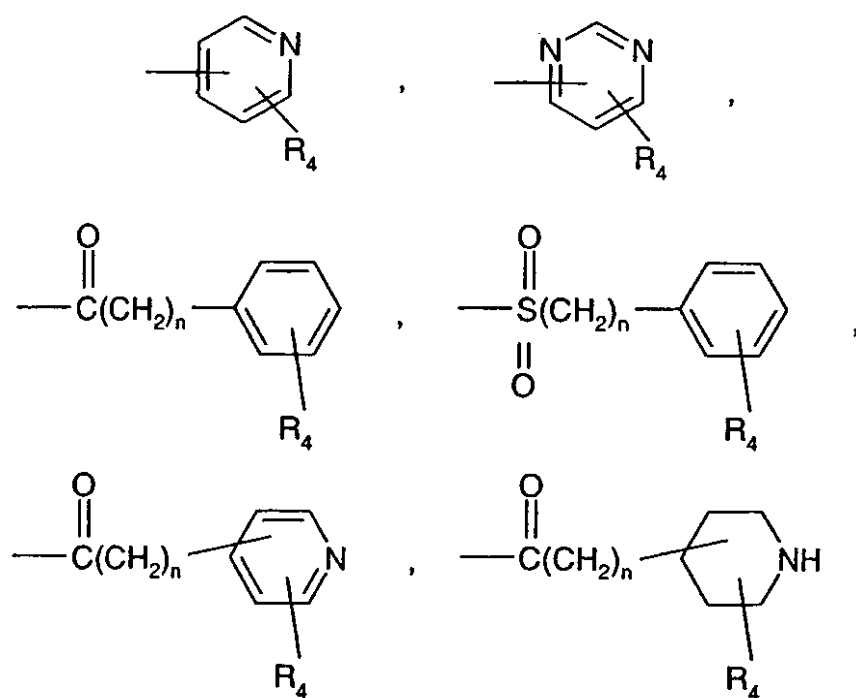
ZはN-RまたはSであり、ここでRは水素、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルカルボニ

ル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルキルカルバモイル— C_{1-6} アルキルおよび C_{1-6} ジアルキルカルバモイル C_{1-6} アルキルよりなる群から選択され；

R_1 は水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} パーフルオロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルキル C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルキル、ヒドロキシ C_{1-6} アルキル、アミノ C_{1-6} アルキル、モノーまたはジ— C_{1-6} アルキル—アミノ C_{1-6} アルキル、ホルミル、 C_{1-6} アルキルカルボニル、アミノ C_{1-6} アルキルカルボニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、フェニル、ジフェニル C_{1-6} アルキルおよびフェニル C_{1-6} アルキル、フェニルカルボニル C_{1-6} アルキル、フェノキシ C_{1-6} アルキルよりなる群から選択され、ここでフェニルは場合により C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} パーフルオロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシまたは C_{1-6} パーフルオロアルキルまたは C_{1-6} パーフルオロアルコキシから各々独立して選択される置換基1個または2個で置換されており；

R_3 は下記式：

【化9】



(式中、

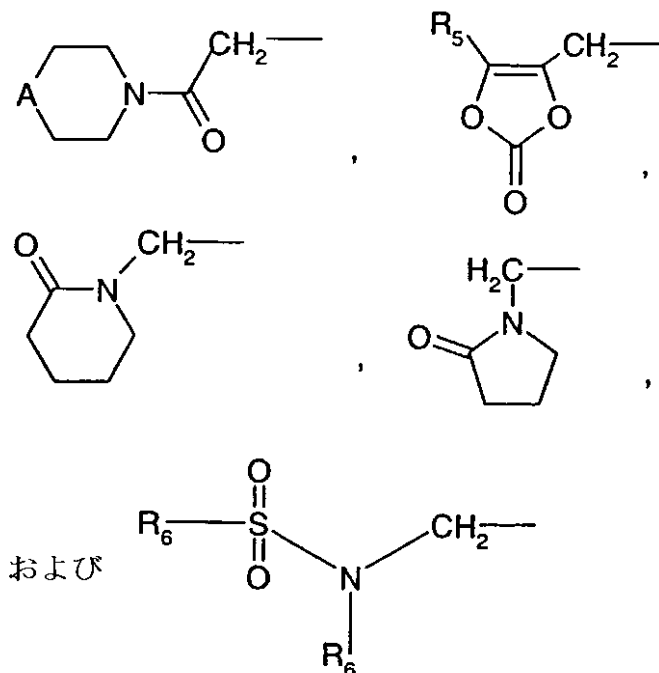
R_4 は水素、ハロゲン、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} パーフルオロアルキル、 C_{1-6} パーフルオロアルコキシ、フェニルおよびベンジルよりなる群から選択され、ここでフェニルまたはベンジルは場合により C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} パーフルオロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシまたは C_{1-6} パーフルオロアルキルまたは C_{1-6} パーフルオロアルコキシから各々独立して選択される置換基1個または2個で置換されており；そして、

n は0～4の整数である)であり；そして、

R_2 は水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} パーフルオロアルキル、パーフルオロアリール、インダニル、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アシルオキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシカルボニルオキシ C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} シクロアルキル、 C_{3-8} シクロアルコキシカルボニルオキシ— C_{1-6} アルキル、アダマンチルオキシカルボニルオキシ C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} シクロアルコキシカルボニル— C_{1-6} アルキル、モノーまたはジ— C_{1-6} アルキルアミノ— C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} アザシクロアルキル C_{1-6} アルキル、モノーまたはジ— C_{1-6} アルキルカルバモイル— C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} アザシクロアルキルカルボニルオキシ C_{1-6} アルキル、ベンジル C_{1-6} アルキルカルバモイル C_{1-6} アルキル、モノーまたはジ— C_{1-6} アルキルカルバモイルオキシ C_{1-6} ア

ルキル、 C_{3-8} アザシクロアルキルカルボニルオキシ- C_{1-6} アルキル、ベンジル C_{1-6} アルキルカルバモイルオキシ C_{1-6} アルキル、ベンジルカルバモイルオキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシカルボニルアミノ-オキシ- C_{1-6} アルキル、下記式：

【化10】



(式中、

R_5 は水素または C_{1-6} アルキルであり、

R_6 は C_{1-6} アルキル、フェニルまたはトリルであり、そして、

Aは CH_2 、NHまたはOである)よりなる群から選択される]の化合物の、または製薬上許容しうるその塩の、場合により製薬上許容しうる担体と組み合わせた使用であって、該化合物が、アレルギー、喘息、鼻炎、皮膚炎、B細胞リンパ腫、腫瘍または細菌、ライノウィルスもしくは呼吸器合胞体ウィルス(RSV)感染に関わる疾患の治療のためにTヘルパー(Th)細胞、Th1/Th2を調節することができる上記使用。

【請求項12】

治療がアレルギーのためのものである請求項11記載の使用。

【請求項13】

治療が喘息のためのものである請求項11記載の使用。

【請求項14】

治療が鼻炎のためのものである請求項11記載の使用。

【請求項15】

治療が皮膚炎のためのものである請求項11記載の使用。

【請求項16】

治療がライノウィルスまたは呼吸器合胞体ウィルス感染に関わる疾患のためのものである請求項11記載の使用。

【請求項17】

式Iにおいて、

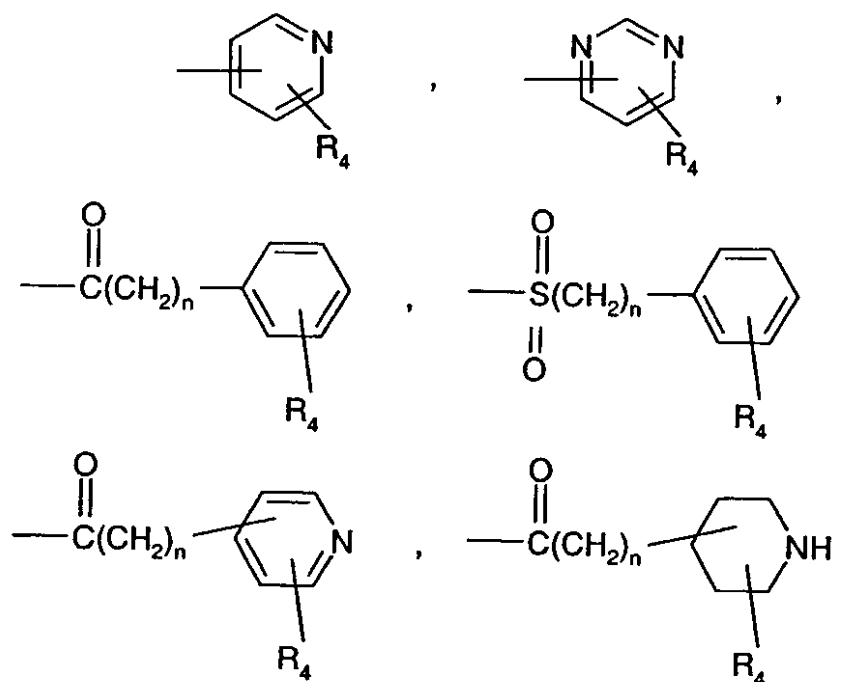
XおよびYは同じかまたは異なっていて、そして独立して、水素、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} パーフルオロアルキル、 C_{1-3} アルコキシ、 C_{1-3} パーフルオロアルコキシ、フェニルおよびベンジルよりなる群から選択され；

ZはN-RまたはSであり、ここでRは水素、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコキシカルボニル C_{1-3} アルキルおよび C_{1-3} ジアルキルカルバモイル- C_{1-3} アルキルよりなる群から選択され；

R_1 は水素、 C_{1-6} アルキルまたはフェニル C_{1-6} アルキルであり；

R₃は下記式：

【化 1 1】



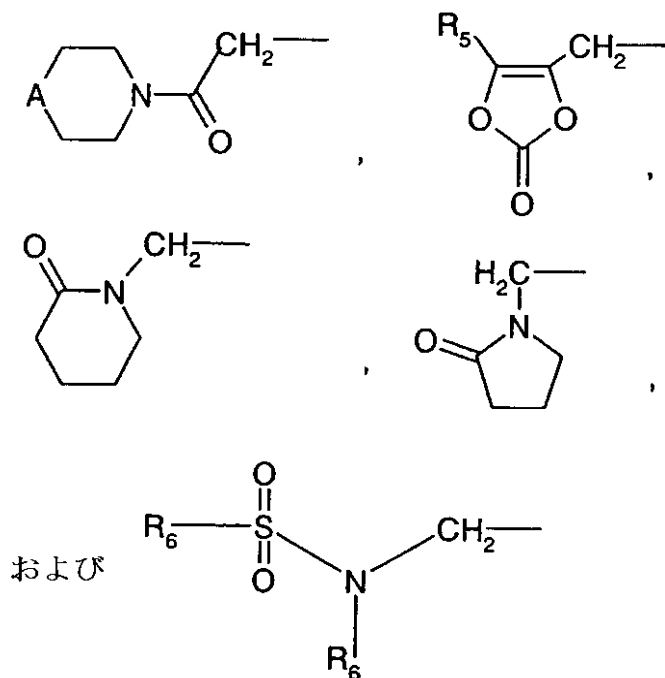
(式中、

R₄は水素またはC₁₋₆アルキルであり；そして、

nは0～3の整数である)であり；そして、

R₂は水素、C₁₋₄アルキル、パーフルオロアリール、インダニル、C₁₋₃アルコキシC₁₋₃アルキル、C₂₋₅アシルオキシC₁₋₃アルキル、C₁₋₃アルコキシカルボニルC₁₋₃アルキル、C₁₋₄アルコキシカルボニルオキシC₁₋₄アルキル、C₄₋₆シクロアルコキシカルボニルオキシ-C₁₋₃アルキル、アダマンチルオキシカルボニルオキシ-C₁₋₃アルキル、モノ-またはジ-C₁₋₃アルキルアミノ-C₁₋₃アルキル、C₄₋₆アザシクロアルキル-C₁₋₃アルキル、モノ-またはジ-C₁₋₃アルキルカルバモイル-C₁₋₃アルキル、C₄₋₆アザシクロアルキルカルボニルC₁₋₃アルキル、ベンジルC₁₋₃アルキルカルバモイル-C₁₋₆アルキル、モノ-またはジ-C₁₋₃アルキルカルバモイルオキシC₁₋₃アルキル、C₃₋₈アザシクロアルキルカルボニルオキシC₁₋₆アルキル、ベンジルカルバモイルオキシC₁₋₃アルキル、C₁₋₃アルコキシカルボニルアミノ-カルボニルC₁₋₃アルキル、下記式：

【化 1 2】



(式中、

R_5 は水素または C_{1-3} アルキルであり、

R_6 は C_{1-6} アルキル、フェニルまたはトリルであり、そして、

AはOである)よりなる群から選択される、

化合物の、または製薬上許容しうるその塩の、場合により製薬上許容しうる担体と組み合わせた請求項11記載の使用。

【請求項18】

式Iにおいて、

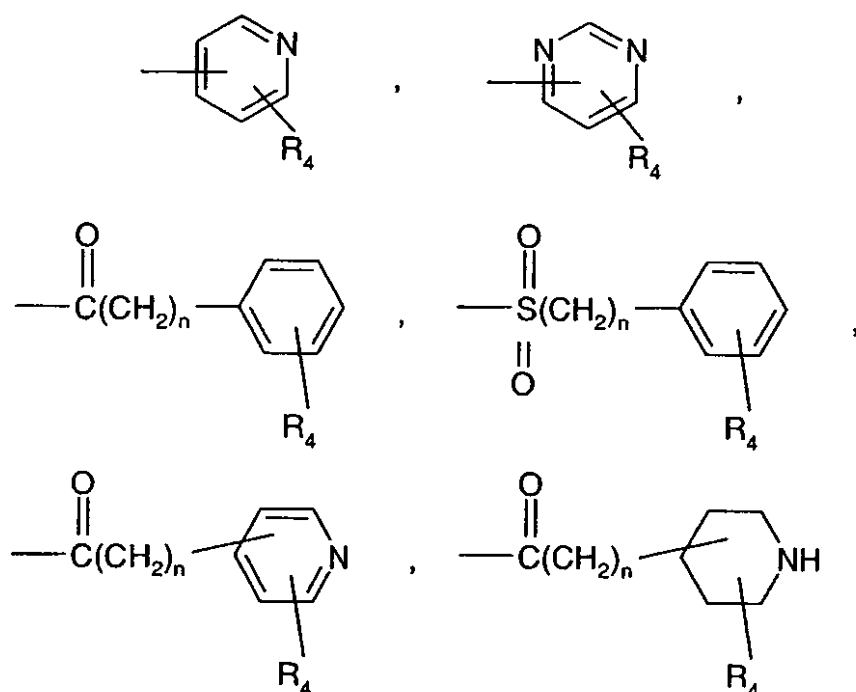
XおよびYは同じかまたは異なっていて、そして独立して水素、フッ素、塩素、トリフルオロメチル、メトキシ、フェニルおよびベンジルよりなる群から選択され；

ZはN-RまたはSであり、ここでRは水素、メチル、エトキシカルボニルメチルおよびジエチルカルバモイルメチルよりなる群から選択され；

R_1 は水素、メチルまたはプロピルであり；

R_3 は下記式：

【化 1 3】

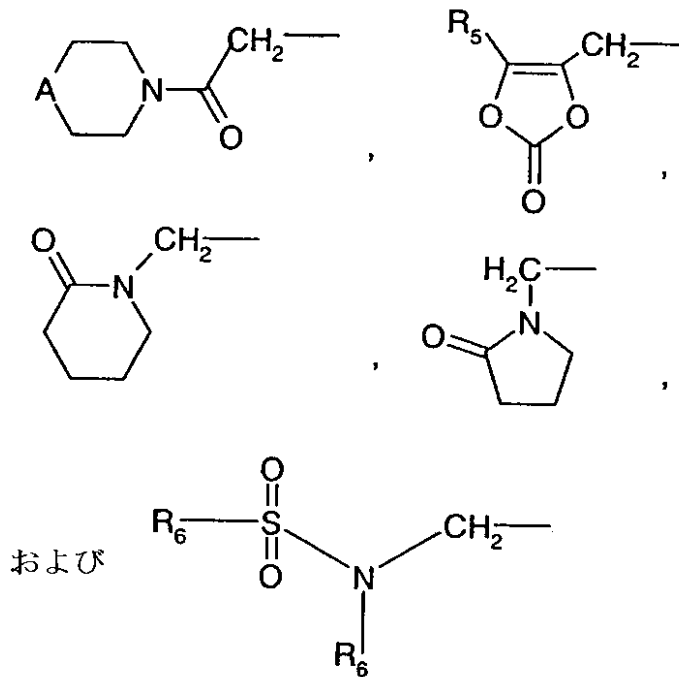


(式中、

 R_4 は水素であり；そして、 n は0～2の整数である)であり；そして、

R_2 は水素、メチル、エチル、*t*-ブチル、ペンタフルオロフェニル、インダニル、メトキシエチル、エトキシプロピル、アセチルオキシメチル、2, 2-ジメチルプロピオニルオキシメチル、ペンタノイルオキシメチル、メトキシカルボニル-1-エチル、エトキシカルボニルメチル、イソプロポキシカルボニルオキシメチル、*t*-ブトキシカルボニルオキシメチル、シクロヘキサノキシカルボニルオキシメチル、アダマンチルオキシカルボニルオキシメチル、ジエチルアミノエチル、ジメチルアミノエチル、ピペリジニル-1-エチル、ジエチルカルバモイルメチル、ベンジルエチルカルバモイルメチル、2-アゼチジン-1-イル-2-オキソ-エチル、2-オキソ-2-ピロリジン-1-イル-エチル、ピペリジン-1-カルボニルオキシメチル、ジエチルカルバモイルオキシメチル、ベンジルカルバモイルオキシメチル、エトキシカルボニルアミノ-カルボニルメチル、下記式：

【化 1 4】



(式中、

R_5 は水素またはメチルであり、

R_6 はメチル、フェニルまたはトリルであり、そして、

AはOである)よりなる群から選択される、

化合物の、または製薬上許容しうるその塩の、場合により製薬上許容しうる担体と組み合わせた請求項1記載の使用。

【請求項19】

化合物が下記：

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル

、
6-トリフルオロメチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

6-クロロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

5-クロロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

6-フルオロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

5-フルオロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

4-フルオロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、t-ブチルエステル、

6-フェニル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、t-ブチルエステル、

5,6-ジメトキシ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

3-メトキシ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、

t-ブチルエステル、

3-(2-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル

、

3-(ピリミジン-2-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

5-フルオロ-1-メチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

4-フルオロ-1-メチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、t-ブチルエステル、

5-クロロ-1-メチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

6-クロロ-1-メチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

1-メチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸マレエート塩、

4-フルオロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸トリフルオロアセテート塩、

4-フルオロ-1-メチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸トリフルオロアセテート塩、

5-メトキシ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸トリフルオロアセテート塩、

6-クロロ-1-ジエチルカルバモイルメチル-3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸ペンタフルオロフェニルエステル、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸2-ジエチルアミノ-エチルエステル、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸2-ジメチルアミノ-エチルエステル、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸2-ピペリジン-1-イル-エチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸(S)-1-メトキシカルボニル-エチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸エトキシカルボニルメチルエステル、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸2-メトキシエチルエステル、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸3-エトキシプロピルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸インダン-5-イルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸ジエチルカルバモイルメチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸2-モルホリン-4-イル-2-オキソ-エチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸2-オキソ-2-ピロリジン-1-イル-エチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸2-アゼチジン-1-イル-2-オキソ-エチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸(ベンジル-

エチル－カルバモイル)－メチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸ジエチルカルバモイルオキシ－メチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸ベンジルカルバモイルオキシメチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸ピペリジン－1－カルボニルオキシメチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸モルホリン－4－カルボニルオキシメチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸2－エトキシカルボニルアミノ－2－オキシ－エチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸イソプロポキシカルボニルオキシ－メチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸1, 1, 2－トリメチルプロポキシ－カルボニルオキシ－メチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸シクロヘキシルオキシ－カルボニルオキシ－メチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸アダマンタン－1－イルオキシカルボニルオキシメチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸アセトキシメチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸2, 2－ジメチル－プロピオニルオキシメチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸ペンタノイルオキシメチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸2－オキソ－ピペリジン－1－イルメチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸(ベンゾイル－エトキシカルボニルメチル－アミノ)－メチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸2－オキソ－ピロリジン－1－イルメチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸5－メチル－2－オキソ－(1, 3)ジオキソ－4－イルメチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸(フェニル－(トルエン－4－スルホニル)－アミノ)－メチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸(ベンゼンスルホニル－メチル－アミノ)－メチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸(メチル－(トルエン－4－スルホニル)－アミノ)－メチルエステル、

3－(ピリジン－4－イルアミノ)－1H－インドール－2－カルボン酸t－ブトキシカルボニルオキシ－メチルエステル、

3－(4－ピリジニルアミノ)－ベンゾ(b)チオフェン－2－カルボン酸エチルエステル、

6－フルオロ－3－(4－ピリジニルアミノ)－ベンゾ(b)チオフェン－2－カルボン酸エチルエステル、

エチル 3－((4－ピリジル)アミノ－N－メチル)－ベンゾ(b)チオフェニル－2－カルボキシレート、

3－(4－ピリジニルアミノ)－6－トリフルオロメチル－ベンゾ(b)チオフェン－2－カルボン酸メタンスルホネート塩、

3－(4－ピリジニルアミノ)－ベンゾ(b)チオフェン－2－カルボン酸塩酸塩、

3- (4-ピリジニルアミノ) -6-トリフルオロメチル-ベンゾ (b) チオフェン-2-カルボン酸エチルエステル塩酸塩、

3- (プロピル-4-ピリジニルアミノ) -ベンゾ (b) チオフェン-2-カルボン酸エチルエステル、

3- ((3-フェニルプロパノイル) メチルアミノ) -1H-6-クロロ-インドール-2-カルボン酸、

3- ((ベンゾイル) メチルアミノ) -4, 6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3- ((ベンゾイル) アミノ) -6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3- ((ベンゾイル) アミノ) -6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸 2-ジメチルアミノ-エチルエステル、

3- ((4-クロロベンゾイル) メチルアミノ) -4, 6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3- ((ベンゾイル) ベンジルアミノ) -4, 6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3- ((4-ピペリジンアシル) メチルアミノ) -6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3- ((ベンゾイル) メチルアミノ) -4, 6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3- ((ベンゾイル) メチルアミノ) -5, 6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3- ((ベンゾイル) エチルアミノ) -4, 6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3- ((ベンゾイル) メチルアミノ) -6-フルオロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3- ((2-ベンジルベンゾイル) アミノ) -4, 6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3- ((3-フルオロベンゾイル) メチルアミノ) -4, 6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3- ((ベンゾイル) ベンジルアミノ) -4, 6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3- ((フェニルスルホニル) アミノ) -4, 6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3- ((フェニルスルホニル) アミノ) -4, 6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、および

3- ((フェニルスルホニル) メチルアミノ) -4, 6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸

よりなる群から選択される請求項 11 記載の使用。

【請求項 20】

化合物が下記：

3- (4-ピリジニルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸、

3- ((3-フェニルプロパノイル) メチルアミノ) -1H-6-クロロ-インドール-2-カルボン酸、

3- ((ベンゾイル) メチルアミノ) -4, 6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3- ((ベンゾイル) アミノ) -6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3- ((ベンゾイル) メチルアミノ) -5, 6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3- ((ベンゾイル) メチルアミノ) -6-フルオロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((4-クロロベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)ベンジルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)エチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((2-ベンジルベンゾイル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((3-フルオロベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((4-ピペリジンアシル)メチルアミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((フェニルスルホニル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((フェニルスルホニル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

6-トリフルオロメチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

3-(ピリミジン-2-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((ベンゾイル)アミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸2-ジメチルアミノ-エチルエステル、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((ベンゾイル)ベンジルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、および、

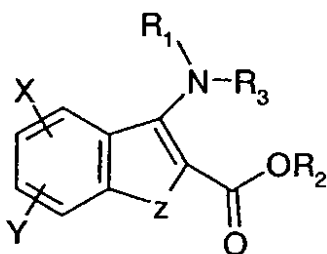
3-((フェニルスルホニル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル

よりなる群から選択される請求項1記載の使用。

【請求項21】

医薬組成物を製造するための下記式(I)：

【化15】



[式中、

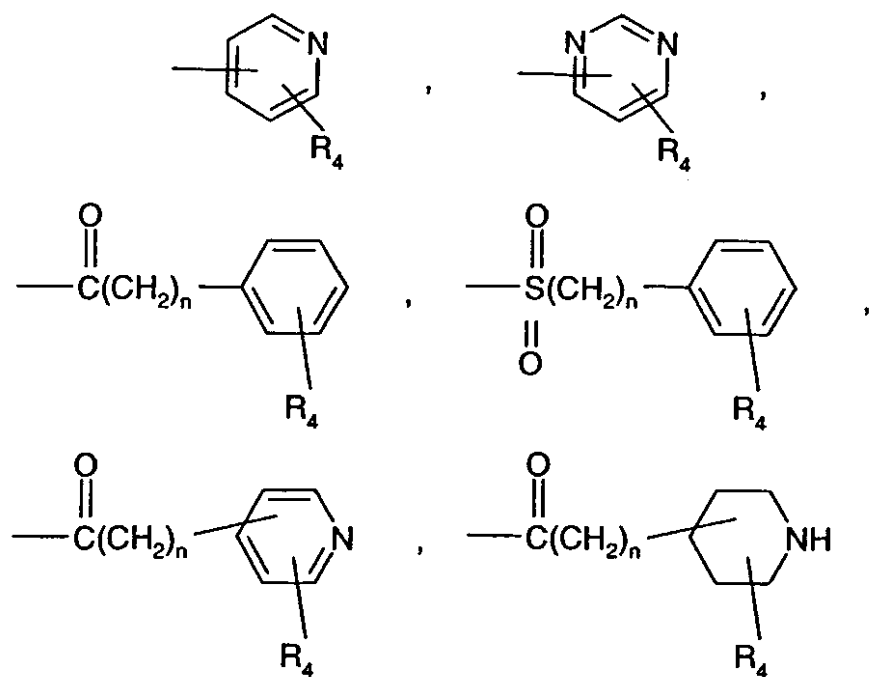
XおよびYは同じかまたは異なっていて、そして独立して水素、ハロゲン、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆パーフルオロアルキル、C₁₋₆パーフルオロアルコキシ、フェニルおよびベンジルよりなる群から選択され、ここでフェニルまたはベンジルは場合によりC₁₋₆アルキル、C₁₋₆パーフルオロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシまたはC₁₋₆パーフルオロアルキルまたはC₁₋₆パーフルオロアルコキシから各々独立して選択される置換基1個または2個で置換されており；

ZはN-RまたはSであり、ここでRは水素、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルカルボニル、C₁₋₆アルコキシカルボニルC₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルカルバモイルーC₁₋₆アルキルおよびC₁₋₆ジアルキルカルバモイルC₁₋₆アルキルよりなる群から選択され；

R₁は水素、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₁₋₆パーフルオロアルキル、C₃₋₈シクロアルキル、C₃₋₈シクロアルキルC₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルキル、ヒドロキシC₁₋₆アルキル、アミノC₁₋₆アルキル、モノーまたはジーC₁₋₆アルキルーアミノC₁₋₆アルキル、ホルミル、C₁₋₆アルキルカルボニル、アミノC₁₋₆アルキルカルボニル、C₁₋₆アルコキシカルボニル、フェニル、ジフェニルC₁₋₆アルキルおよびフェニルC₁₋₆アルキル、フェニルカルボニルC₁₋₆アルキル、フェノキシC₁₋₆アルキルよりなる群から選択され、ここでフェニルは場合によりC₁₋₆アルキル、C₁₋₆パーフルオロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシまたはC₁₋₆パーフルオロアルキルまたはC₁₋₆パーフルオロアルコキシから各々独立して選択される置換基1個または2個で置換されており；

R₃は下記式：

【化16】



(式中、

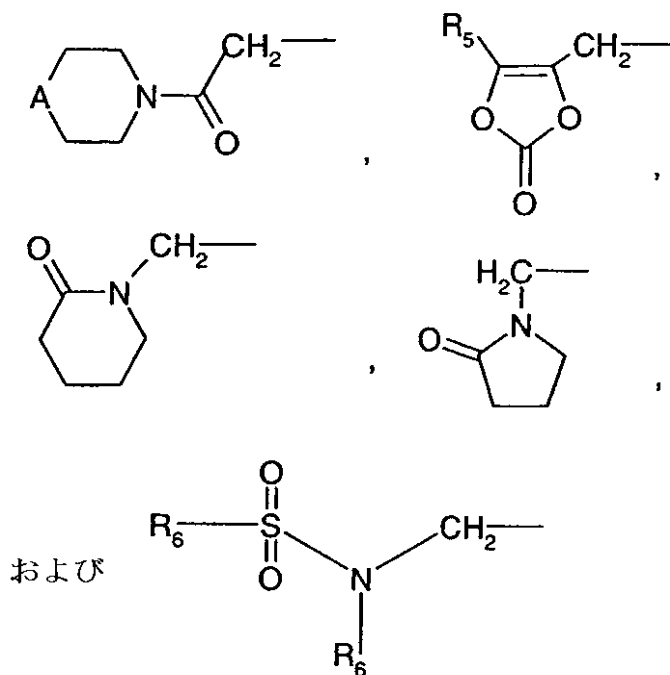
R₄は水素、ハロゲン、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシ、C₁₋₆パーフルオロアルキル、C₁₋₆パーフルオロアルコキシ、フェニルおよびベンジルよりなる群から選択され、ここでフェニルまたはベンジルは場合によりC₁₋₆アルキル、C₁₋₆パーフルオロアルキル、ハロゲン、ヒドロキシまたはC₁₋₆パーフルオロアルキルまたはC₁₋₆パーフルオロアルコキシから各々独立して選択される置換基1個または2個で置換されており；そして、

nは0～4の整数である)であり；そして、

R₂は水素、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆パーフルオロアルキル、パーフルオロアリール、インダニル、C₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルキル、C₂₋₆アシルオキシC₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシカルボニルC₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルコキシカルボニルオキシC₁₋₆アルキル、C₃₋₈シクロアルキル、C₃₋₈シクロアルコキシカルボニルオキシC₁₋₆アルキル、アダマンチルオキシカルボニルオキシC₁₋₆アルキル、C₃₋₈シクロアルコキシカルボニルC₁₋₆アルキル、モノーまたはジーC₁₋₆アルキルアミノC₁₋₆アルキル、C₃₋₈アザシクロアルキルC₁₋₆アルキル、モノーまたはジーC₁₋₆アルキルカルバモイルーC₁₋₆アルキル、C₃₋₈アザシクロアルキルカルボニルオキシC₁₋₆アルキル、ベンジルC₁₋₆アルキルカ

ルバモイル C_{1-6} アルキル、モノーまたはジー C_{1-6} アルキルカルバモイルオキシ C_{1-6} アルキル、 C_{3-8} アザシクロアルキルカルボニルオキシ C_{1-6} アルキル、ベンジル C_{1-6} アルキルカルバモイルオキシ C_{1-6} アルキル、ベンジルカルバモイルオキシ C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシカルボニルアミノーオキシ C_{1-6} アルキル、下記式：

【化 17】



(式中、

R_5 は水素または C_{1-6} アルキルであり、

R_6 は C_{1-6} アルキル、フェニルまたはトリルであり、そして、

A は CH_2 、NH または O である) よりなる群から選択される] の化合物の、または製薬上許容しうるその塩の、場合により製薬上許容しうる担体と組み合わせた使用であって、該化合物が、アレルギー、喘息、鼻炎または皮膚炎の治療のためにインターロイキン-4 (IL-4) メッセージの転写、IL-4 放出または IL-4 生産を抑制することができる上記使用。

【請求項 22】

治療がアレルギーのためのものである請求項 21 記載の使用。

【請求項 23】

治療が喘息のためのものである請求項 21 記載の使用。

【請求項 24】

治療が鼻炎のためのものである請求項 21 記載の使用。

【請求項 25】

治療が皮膚炎のためのものである請求項 21 記載の使用。

【請求項 26】

式 I において、

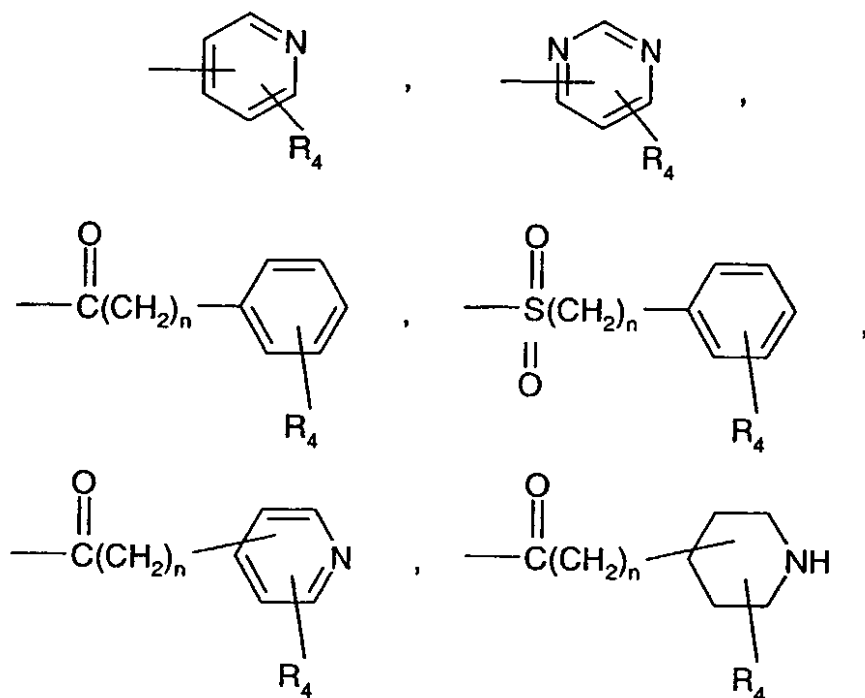
X および Y は同じかまたは異なっていて、そして独立して水素、ハロゲン、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} パーフルオロアルキル、 C_{1-3} アルコキシ、 C_{1-3} パーフルオロアルコキシ、フェニルおよびベンジルよりなる群から選択され；

Z は N-R または S であり、ここで R は水素、 C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコキシカルボニル C_{1-3} アルキルおよび C_{1-3} ジアルキルカルバモイル- C_{1-3} アルキルよりなる群から選択され；

R_1 は水素、 C_{1-6} アルキルまたはフェニル C_{1-6} アルキルであり；

R_3 は下記式：

【化 18】

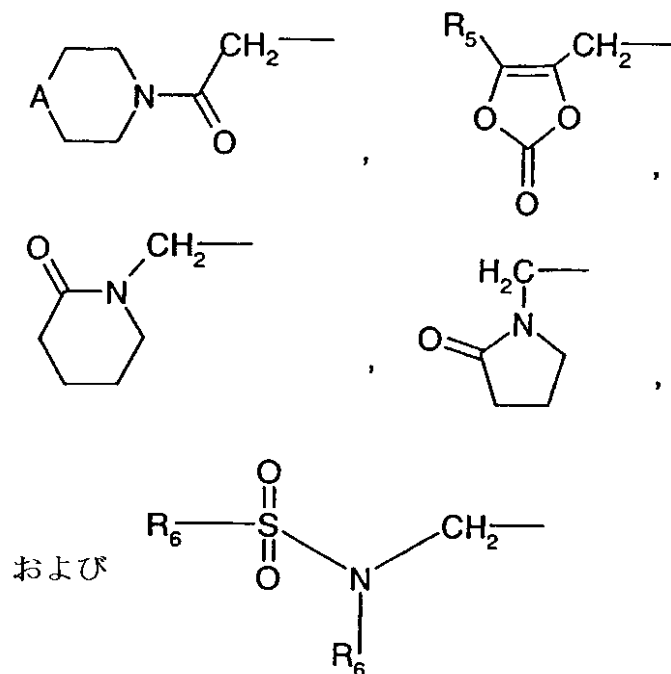


(式中、

 R_4 は水素または C_{1-6} アルキルであり；そして、 n は0～3の整数である)であり；

R_2 は水素、 C_{1-4} アルキル、パーフルオロアリール、インダニル、 C_{1-3} アルコキシ C_{1-3} アルキル、 C_{2-5} アシルオキシ C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコシカルボニル C_{1-3} アルキル、 C_{1-4} アルコシカルボニルオキシ C_{1-4} アルキル、 C_{4-6} シクロアルコシカルボニルオキシ C_{1-3} アルキル、アダマンチルオキシカルボニルオキシ C_{1-3} アルキル、モノーまたはジ C_{1-3} アルキルアミノ C_{1-3} アルキル、 C_{4-6} アザシクロアルキル C_{1-3} アルキル、モノーまたはジ C_{1-3} アルキルカルバモイル C_{1-3} アルキル、 C_{4-6} アザシクロアルキルカルボニル C_{1-3} アルキル、ベンジル C_{1-3} アルキルカルバモイル C_{1-6} アルキル、モノーまたはジ C_{1-3} アルキルカルバモイルオキシ C_{1-3} アルキル、 C_{3-8} アザシクロアルキルカルボニルオキシ C_{1-6} アルキル、ベンジルカルバモイルオキシ C_{1-3} アルキル、 C_{1-3} アルコシカルボニルアミノカルボニル C_{1-3} アルキル、下記式：

【化 19】



(式中、

R_5 は水素または C_{1-3} アルキルであり、

R_6 は C_{1-6} アルキル、フェニルまたはトリルであり、そして、

AはOである)よりなる群から選択される、

化合物の、または製薬上許容しうるその塩の、場合により製薬上許容しうる担体と組み合わせた請求項21記載の使用。

【請求項27】

式Iにおいて、

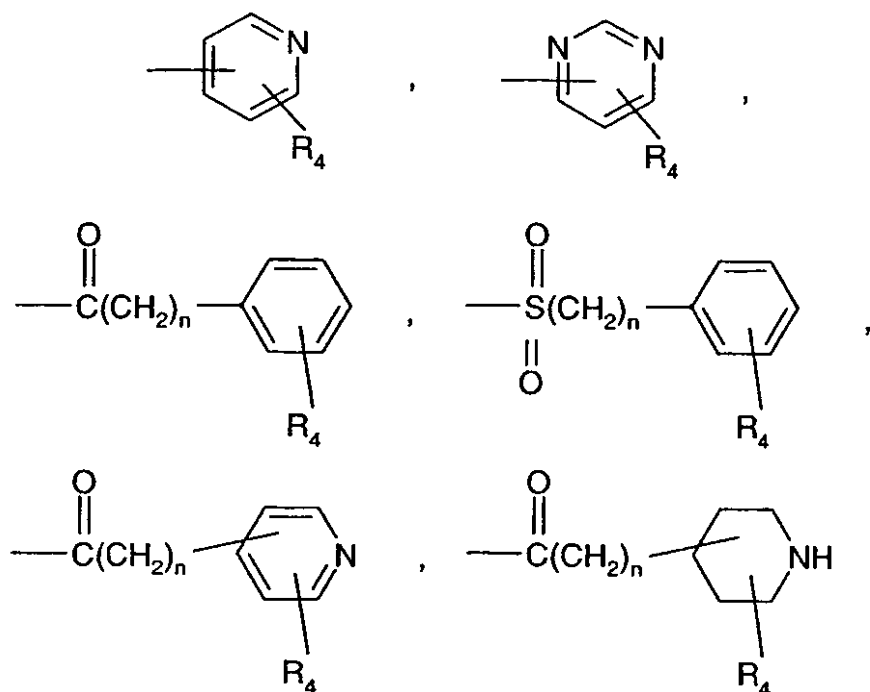
XおよびYは同じかまたは異なっていて、そして独立して水素、フッ素、塩素、トリフルオロメチル、メトキシ、フェニルおよびベンジルよりなる群から選択され；

ZはN-RまたはSであり、ここでRは水素、メチル、エトキシカルボニルメチルおよびジエチルカルバモイルメチルよりなる群から選択され；

R_1 は水素、メチルまたはプロピルであり；

R_3 は下記式：

【化 20】



(式中、

 R_4 は水素であり；そして、 n は0～2の整数である)であり；そして、

R_2 は水素、メチル、エチル、*t*-ブチル、ペンタフルオロフェニル、インダニル、メトキシエチル、エトキシプロピル、アセチルオキシメチル、2, 2-ジメチルプロピオニルオキシメチル、ペンタノイルオキシメチル、メトキシカルボニル-1-エチル、エトキシカルボニルメチル、イソプロポキシカルボニルオキシメチル、*t*-ブトキシカルボニルオキシメチル、シクロヘキサノキシカルボニルオキシメチル、アダマンチルオキシカルボニルオキシメチル、ジエチルアミノエチル、ジメチルアミノエチル、ピペリジニル-1-エチル、ジエチルカルバモイルメチル、ベンジルエチルカルバモイルメチル、2-アゼチジン-1-イル-2-オキソ-エチル、2-オキソ-2-ピロリジン-1-イル-エチル、ピペリジン-1-カルボニルオキシメチル、ジエチルカルバモイルオキシメチル、ベンジルカルバモイルオキシメチル、エトキシカルボニルアミノ-カルボニルメチル、下記式：

*CC(=O)N1CCCCC1A, *CC1=C(R5)OC(=O)O1,
*CN1CCCC1=O, *CN1CCCC1=O,
 および *S(=O)(=O)N(R6)C

3-メトキシ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、
t-ブチルエステル、

3 - (2 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸、エチルエステル、

3 - (ピリミジン - 2 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸エチルエステル、

5 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸、エチルエステル、

4 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸、t - ブチルエステル、

5 - クロロ - 1 - メチル - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸、エチルエステル、

6 - クロロ - 1 - メチル - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸、エチルエステル、

1 - メチル - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸マレーエート塩、

4 - フルオロ - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸トリフルオロアセテート塩、

4 - フルオロ - 1 - メチル - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸トリフルオロアセテート塩、

5 - メトキシ - 3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸トリフルオロアセテート塩、

6 - クロロ - 1 - ジエチルカルバモイルメチル - 3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸エチルエステル、

3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸ペンタフルオロフェニルエステル、

3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸2 - ジエチルアミノ - エチルエステル、

3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸2 - ジメチルアミノ - エチルエステル、

3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸2 - ピペリジン - 1 - イル - エチルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸(S) - 1 - メトキシカルボニル - エチルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸エトキシカルボニルメチルエステル、

3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸2 - メトキシエチルエステル、

3 - (4 - ピリジニルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸3 - エトキシプロピルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸インダン - 5 - イルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸ジエチルカルバモイルメチルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸2 - モルホリン - 4 - イル - 2 - オキソ - エチルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸2 - オキソ - 2 - ピロリジン - 1 - イル - エチルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸2 - アゼチジン - 1 - イル - 2 - オキソ - エチルエステル、

3 - (ピリジン - 4 - イルアミノ) - 1 H - インドール - 2 - カルボン酸(ベンジル - エチル - カルバモイル) - メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸ジエチルカルバモイルオキシ-メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸ベンジルカルバモイルオキシ-メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸ピペリジン-1-カルボニルオキシ-メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸モルホリン-4-カルボニルオキシ-メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸2-エトキシカルボニルアミノ-2-オキシ-エチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸イソプロポキシカルボニルオキシ-メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸1, 1, 2-トリメチルプロポキシ-カルボニルオキシ-メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸シクロヘキシルオキシ-カルボニルオキシ-メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸アダマンタン-1-イルオキシカルボニルオキシ-メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸アセトキシ-メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸2, 2-ジメチル-プロピオニルオキシ-メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸ペンタノイルオキシ-メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸2-オキソ-ピペリジン-1-イルメチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸 (ベンゾイル-エトキシカルボニルメチル-アミノ) -メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸2-オキソ-ピロリジン-1-イルメチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸5-メチル-2-オキソ- (1, 3) ジオキソ-4-イルメチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸 (フェニル- (トルエン-4-スルホニル) -アミノ) -メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸 (ベンゼンスルホニル-メチル-アミノ) -メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸 (メチル- (トルエン-4-スルホニル) -アミノ) -メチルエステル、

3- (ピリジン-4-イルアミノ) -1H-インドール-2-カルボン酸t-ブトキシカルボニルオキシ-メチルエステル、

3- (4-ピリジニルアミノ) -ベンゾ (b) チオフェン-2-カルボン酸エチルエステル、

6-フルオロ-3- (4-ピリジニルアミノ) -ベンゾ (b) チオフェン-2-カルボン酸エチルエステル、

エチル 3- ((4-ピリジル) アミノ-N-メチル) -ベンゾ (b) チオフェニル-2-カルボキシレート、

3- (4-ピリジニルアミノ) -6-トリフルオロメチル-ベンゾ (b) チオフェン-2-カルボン酸メタンスルホネート塩、

3- (4-ピリジニルアミノ) -ベンゾ (b) チオフェン-2-カルボン酸塩酸塩、

3- (4-ピリジニルアミノ) -6-トリフルオロメチル-ベンゾ (b) チオフェン-

2-カルボン酸エチルエステル塩酸塩、

3-(プロピル-4-ピリジニルアミノ)-ベンゾ(b)チオフェン-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((3-フェニルプロパノイル)メチルアミノ)-1H-6-クロロインドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)アミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)アミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸2-ジメチルアミノエチルエステル、

3-((4-クロロベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)ベンジルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((4-ピペリジンアシル)メチルアミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-5,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)エチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-6-フルオロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((2-ベンジルベンゾイル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((3-フルオロベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)ベンジルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((フェニルスルホニル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((フェニルスルホニル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、および

3-((フェニルスルホニル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸

よりなる群から選択される請求項21記載の使用。

【請求項29】

化合物が下記：

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((3-フェニルプロパノイル)メチルアミノ)-1H-6-クロロインドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)アミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-5,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-6-フルオロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((4-クロロベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール

ル-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)ベンジルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)エチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((2-ベンジルベンゾイル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((3-フルオロベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((4-ピペリジンアシル)メチルアミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((フェニルスルホニル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((フェニルスルホニル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

6-トリフルオロメチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

3-(ピリミジン-2-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((ベンゾイル)アミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸2-ジメチルアミノ-エチルエステル、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((ベンゾイル)ベンジルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、および、

3-((フェニルスルホニル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル

よりなる群から選択される請求項21記載の使用。

【請求項30】

化合物が更にインターロイキン-5(IL-5)メッセージの転写、IL-5放出またはIL-5生産を抑制することができる請求項21記載の使用。

【請求項31】

化合物が更にインターロイキン-13(IL-13)メッセージの転写、IL-13放出またはIL-13生産を抑制することができる請求項21記載の使用。

【請求項32】

製薬上許容しうる担体少なくとも1種と組み合わせたアレルギー、喘息、鼻炎、皮膚炎、B-細胞リンパ腫、腫瘍または細菌、ライノウィルスもしくは呼吸器合胞体ウィルス(RSV)感染に関わる疾患の治療に有効な量の請求項1記載の化合物を含有する医薬組成物。

【請求項33】

化合物が下記：

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

6-トリフルオロメチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

6-クロロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

5-クロロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

6-フルオロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

5-フルオロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

4-フルオロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、t-ブチルエステル、

6-フェニル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、t-ブチルエステル、

5, 6-ジメトキシ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

3-メトキシ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、t-ブチルエステル、

3-(2-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

3-(ピリミジン-2-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

5-フルオロ-1-メチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

4-フルオロ-1-メチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、t-ブチルエステル、

5-クロロ-1-メチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

6-クロロ-1-メチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

1-メチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸マレエート塩、

4-フルオロ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸トリフルオロアセテート塩、

4-フルオロ-1-メチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸トリフルオロアセテート塩、

5-メトキシ-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸トリフルオロアセテート塩、

6-クロロ-1-ジエチルカルバモイルメチル-3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸ペンタフルオロフェニルエステル、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸2-ジエチルアミノ-エチルエステル、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸2-ジメチルアミノ-エチルエステル、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸2-ピペリジン-1-イル-エチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸(S)-1-メトキシカルボニル-エチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸エトキシカルボニルメチルエステル、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 2-メトキシエチルエステル、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 3-エトキシプロピルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 インダン-5-イルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 ジエチルカルバモイルメチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 2-モルホリン-4-イル-2-オキソ-エチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 2-オキソ-2-ピロリジン-1-イル-エチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 2-アゼチジン-1-イル-2-オキソ-エチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 (ベンジル-エチル-カルバモイル)-メチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 ジエチルカルバモイルオキシ-メチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 ベンジルカルバモイルオキシメチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 ピペリジン-1-カルボニルオキシメチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 モルホリン-4-カルボニルオキシメチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 2-エトキシカルボニルアミノ-2-オキシ-エチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 イソプロポキシカルボニルオキシ-メチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 1, 1, 2-トリメチルプロポキシ-カルボニルオキシ-メチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 シクロヘキシルオキシ-カルボニルオキシ-メチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 アダマンタン-1-イルオキシカルボニルオキシメチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 アセトキシメチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 2, 2-ジメチル-プロピオニルオキシメチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 ペンタノイルオキシメチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 2-オキソ-ピペリジン-1-イルメチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 (ベンゾイル-エトキシカルボニルメチル-アミノ)-メチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 2-オキソ-ピロリジン-1-イルメチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 5-メチル-2-オキソ-(1, 3)ジオキソ-4-イルメチルエステル、

3-(ピリジン-4-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸 (フェニル-(トルエン-4-スルホニル)-アミノ)-メチルエステル、

3-（ピリジン-4-イルアミノ）-1H-インドール-2-カルボン酸（ベンゼンスルホニル-メチル-アミノ）-メチルエステル、

3-（ピリジン-4-イルアミノ）-1H-インドール-2-カルボン酸（メチル-（トルエン-4-スルホニル）-アミノ）-メチルエステル、

3-（ピリジン-4-イルアミノ）-1H-インドール-2-カルボン酸 t-ブトキシカルボニルオキシ-メチルエステル、

3-（4-ピリジニルアミノ）-ベンゾ（b）チオフェン-2-カルボン酸エチルエステル、

6-フルオロ-3-（4-ピリジニルアミノ）-ベンゾ（b）チオフェン-2-カルボン酸エチルエステル、

エチル 3-（（4-ピリジル）アミノ-N-メチル）-ベンゾ（b）チオフェニル-2-カルボキシレート、

3-（4-ピリジニルアミノ）-6-トリフルオロメチル-ベンゾ（b）チオフェン-2-カルボン酸メタンスルホネート塩、

3-（4-ピリジニルアミノ）-ベンゾ（b）チオフェン-2-カルボン酸塩酸塩、

3-（4-ピリジニルアミノ）-6-トリフルオロメチル-ベンゾ（b）チオフェン-2-カルボン酸エチルエステル塩酸塩、

3-（プロピル-4-ピリジニルアミノ）-ベンゾ（b）チオフェン-2-カルボン酸エチルエステル、

3-（（3-フェニルプロパノイル）メチルアミノ）-1H-6-クロロ-インドール-2-カルボン酸、

3-（（ベンゾイル）メチルアミノ）-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-（（ベンゾイル）アミノ）-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-（（ベンゾイル）アミノ）-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸 2-ジメチルアミノ-エチルエステル、

3-（（4-クロロベンゾイル）メチルアミノ）-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-（（ベンゾイル）ベンジルアミノ）-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-（（4-ピペリジンアシル）メチルアミノ）-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-（（ベンゾイル）メチルアミノ）-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-（（ベンゾイル）メチルアミノ）-5,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-（（ベンゾイル）エチルアミノ）-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-（（ベンゾイル）メチルアミノ）-6-フルオロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-（（2-ベンジルベンゾイル）アミノ）-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-（（3-フルオロベンゾイル）メチルアミノ）-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-（（ベンゾイル）ベンジルアミノ）-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-（（フェニルスルホニル）アミノ）-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-（（フェニルスルホニル）アミノ）-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、および

3-((フェニルスルホニル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸

よりなる群から選択される請求項32記載の組成物。

【請求項34】

化合物が下記：

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((3-フェニルプロパノイル)メチルアミノ)-1H-6-クロロ-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)アミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-5,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-6-フルオロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((4-クロロベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)ベンジルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((ベンゾイル)エチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((2-ベンジルベンゾイル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((3-フルオロベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((4-ピペリジンアシル)メチルアミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((フェニルスルホニル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-((フェニルスルホニル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸、

3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル

、

6-トリフルオロメチル-3-(4-ピリジニルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸、エチルエステル、

3-(ピリミジン-2-イルアミノ)-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((ベンゾイル)アミノ)-6-クロロ-1H-インドール-2-カルボン酸2-ジメチルアミノ-エチルエステル、

3-((ベンゾイル)メチルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、

3-((ベンゾイル)ベンジルアミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル、および、

3-((フェニルスルホニル)アミノ)-4,6-ジクロロ-1H-インドール-2-カルボン酸エチルエステル

よりなる群から選択される請求項32記載の組成物。